

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

THIS PAGE BLANK (USPTO)

09/691, 915



PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
 Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6 : C07D 307/54, 307/46, 333/24, 333/22, 263/32, 263/10, 261/08, 261/04, 277/30, 277/26, 271/06, A01N 43/08, 43/10, 43/28		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 96/26200 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 29. August 1996 (29.08.96)	
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP96/00593		<p>[DE/DE]; Sebastian-Kneipp-Strasse 17, D-67105 Schifferstadt (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Am Herz 40, D-67433 Neustadt (DE).</p> <p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, CA, CN, CZ, EE, FI, GE, HU, JP, KR, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, SG, SK, TR, UA, US, UZ, VN, eurasisches Patent (AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p>		
(22) Internationales Anmeldedatum: 13. Februar 1996 (13.02.96)				
(30) Prioritätsdaten: 195 06 574.3 24. Februar 1995 (24.02.95) DE				
(71) Anmelder (<i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i>): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE)				
(72) Erfinder; und				
(75) Erfinder/Anmelder (<i>nur für US</i>): VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; Lüderitzstrasse 4, D-67434 Neustadt (DE). HILL, Regina, Luise [DE/DE]; Ziegelofenweg 40, D-67346 Speyer (DE). KARDORFF, Uwe [DE/DE]; D 3,4, D-68159 Mannheim (DE). ENGEL, Stefan [DE/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 13, D-65510 Idstein (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). VOSSEN, Marcus [DE/DE]; Wilhelm-Wundt-Strasse 7, D-68199 Mannheim (DE). PLATH, Peter [DE/DE]; Hans-Balcke-Strasse 13, D-67227 Frankenthal (DE). RANG, Harald [DE/DE]; Ziegeleistrasse 7, D-67122 Altrip (DE). HARREUS, Albrecht [DE/DE]; Beuthener Strasse 10, D-67063 Ludwigshafen (DE). RÖHL, Franz				
(54) Title: HERBICIDAL BENZOYL DERIVATIVES		Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i>		
(54) Bezeichnung: HERBIZIDE BENZOYLDERIVATE				
(57) Abstract				
<p>The invention concerns benzoyl derivatives of formula (I) in which the substituents have the following meanings: L and M represent hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₄ alkoxy (these groups being optionally substituted by one to five halogen atoms or C₁-C₄ alkoxy), halogen, cyano, nitro, a -(Y)_n-S(O)_mR⁷ or -(Y)_n-CO-R⁸ group; Z represents a five to six-membered heterocyclic saturated or unsaturated group containing one to three heteroatoms selected from the group comprising oxygen, sulphur and nitrogen and which can optionally be substituted by halogen, cyano, nitro, a -CO-R⁸ group, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide, C₃-C₈ cycloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkoxy halide, C₁-C₄ alkyl thio, C₁-C₄ alkyl thio halide, di-C₁-C₄ alkyl amino, phenyl optionally substituted by halogen, cyano, nitro, C₁-C₄ alkyl or C₁-C₄ alkyl halide, or an oxo group which can be present in the tautomeric form as a hydroxy group, is substituted or, together with a condensation-bound phenyl ring which is optionally substituted by halogen or, cyano, nitro, C₁-C₄ alkyl or C₁-C₄ alkyl halide, with a condensation-bound carbocycle or with a condensation-bound second heterocycle which can optionally be substituted by halogen, cyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, di-C₁-C₄ alkyl amino, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkoxy halide or a C₁-C₄ alkyl halide, forms a bicyclic system; Y represents O or NR⁹; n is 0 or 1; m is 0, 1 or 2; R⁷ represents C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide or NR⁹R¹⁰; R⁸ represents C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide, C₁-C₄ alkoxy or NR⁹R¹⁰; R⁹ represents hydrogen or C₁-C₄ alkyl; R¹⁰ represents C₁-C₄ alkyl; Q represents a cyclohexane-1,2-dione ring connected at position 2 and of formula (II) in which R¹, R², R⁴ and R⁶ represent hydrogen or C₁-C₄ alkyl, R⁵ represents hydrogen, C₁-C₄ alkyl or a -COOR¹⁰ group, R³ represents hydrogen, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl, these groups optionally including one to three of the following substituents: halogen, C₁-C₄ alkyl thio, C₁-C₄ alkoxy, or R³ represents tetrahydropropenyl-3, tetrahydropropenyl-4 or tetrahydrothiopyranyl-3, or R³ and R⁵ together form a bond or a three to six-membered carbocyclic ring. The invention also concerns standard agricultural salts of compounds of formula (I) usually utilized in agriculture.</p>		 (I)		
		 (II)		
		 (III)		

(57) Zusammenfassung

Benzoylderivate der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutungen haben: L, M Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch ein bis fünf Halogenatome oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können, Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -(Y)_n-S(O)_mR⁷ oder eine Gruppe -(Y)_n-CO-R⁸, ein 5- oder 6-gliedriger heterocyclicischer, gesättigter oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R⁸, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylothio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-C₁-C₄-Alkylamino, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, Di-C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet; Y O, NR⁹; n null oder eins; m null, eins oder zwei; R⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder NR⁹R¹⁰; R⁸ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, oder NR⁹R¹⁰; R⁹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl; R¹⁰ C₁-C₄-Alkyl; Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dionring der Formel (II), in welcher R¹, R², R⁴ und R⁶ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeuten, R⁵ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder eine Gruppe -COOR¹⁰ bedeutet, R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl bedeutet, wobei diese Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₄-Alkylothio, oder C₁-C₄-Alkoxy, oder R³ Tetrahydropyran-3, Tetrahydropyran-4 oder Tetrahydrothiopyran-3 bedeutet, oder R³ und R⁵ gemeinsam eine Bindung oder einen drei- bis sechs-gliedrigen carbocyclischen Ring bilden, sowie landwirtschaftlich übliche Salze der Verbindungen (I).

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereiniges Königreich	MX	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumänien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		

Herbizide Benzooylderivate**Beschreibung****5**

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Benzooylderivate mit herbizider Wirkung, Verfahren zur Herstellung der Benzooylderivate, Mittel welche diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder sie enthaltender Mittel zur Unkrautbekämpfung.

10

Aus der Literatur sind herbizidwirksame 2-Aroylcyclohexandione bekannt, beispielsweise aus EP 90262, EP 135191, EP 186118, EP 186119, EP 186120, EP 319075, WO 9005712, J0 3052862 und J0 3120202.

15

Die herbiziden Eigenschaften der bekannten Verbindungen sowie die Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen können jedoch nur bedingt befriedigen.

20 Die Aufgabe bestand darin neue 2-Aroylcyclohexandione mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

Es wurden nun neue Benzooylderivate der Formel I gefunden

25

30 in der die Substituenten folgende Bedeutungen haben:

L, M Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch ein bis fünf Halogenatome oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können, Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -(Y)_n-S(O)_m-R⁷ oder eine Gruppe -(Y)_n-CO-R⁸,

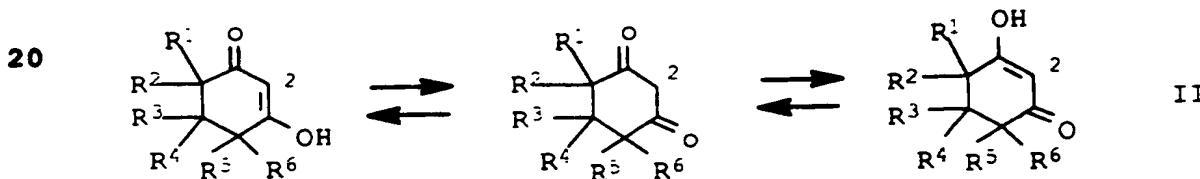
35

Z ein 5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R⁸, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-C₁-C₄-Alkylamino oder gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem

2

ankondensierten durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl,
 5 Di-C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet,

Y O, NR⁹,
 10 n null oder eins,
 m null, eins oder zwei,
 R⁷ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder NR⁹R¹⁰,
 R⁸ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, oder NR⁹R¹⁰,
 R⁹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl,
 15 R¹⁰ C₁-C₄-Alkyl,
 Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dionring der Formel II,



25 in welcher

R¹, R², R⁴ und R⁶ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeuten,
 R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder eine Gruppe -COOR¹⁰ bedeutet,
 R⁵ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl bedeutet, wobei
 30 diese Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₄-Alkylthio, oder C₁-C₄-Alkoxy,

oder

35 R³ Tetrahydropyranyl-3, Tetrahydropyranyl-4 oder Tetrahydrothiopyranyl-3 bedeutet,

oder

40 R³ und R⁵ gemeinsam eine Bindung oder einen drei- bis sechsgliedrigen carbocyclischen Ring bilden,

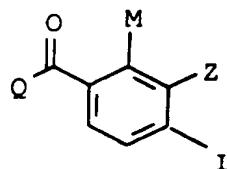
sowie landwirtschaftlich übliche Salze der Verbindungen I.

45

3

Bevorzugt sind Benzooylderivate der Formel Ia

5

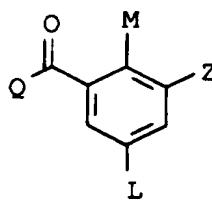


Ia

in der L für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,
10 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogen-
 alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen,
 Nitro oder Cyano und M für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl,
 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio,
 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
15 C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano steht und Q und Z
 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind auch Benzooylderivate der Formel Ib

20



Ib

25

in der L und M für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogen-
 alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen,
 Nitro oder Cyano stehen und Q und Z die in Anspruch 1 angegebenen
30 Bedeutungen haben.

Verbindungen der Formel Ic erhält man dadurch, daß man

Verbindungen der Formel II mit einem Benzoësäurederivat der For-

mel III umsetzt und zu Benzooylderivaten der Formel Ic umlagert:

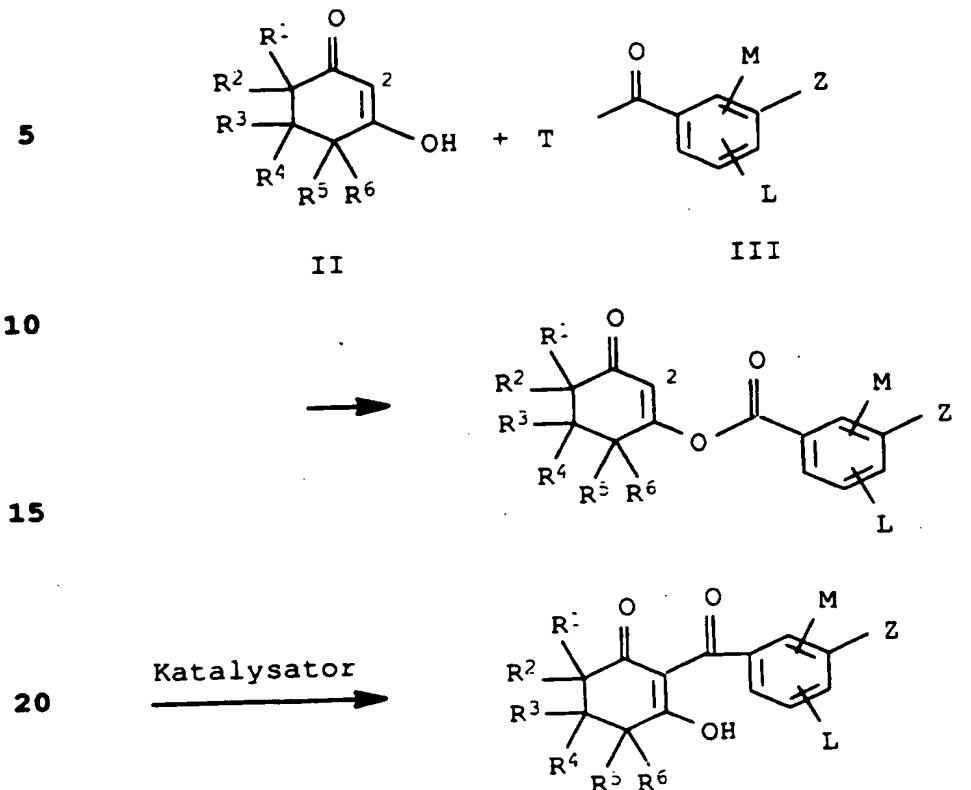
35

40

45

4

Schema 1



25 In den oben genannten Formeln hat T die Bedeutung Halogen und L, M und Z die oben angegebene Bedeutung.

Der erste Schritt der Reaktionsabfolge, die Acylierung, erfolgt in allgemein bekannter Weise, z. B. durch Zugabe eines Säurechlorids der Formel III ($T=Cl$) zur Lösung oder Suspension eines Cyclohexan-1,3-dions II in Gegenwart einer Hilfsbase. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßig in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß, z.B. 1,2 bis 1,5-Mol-äquivalente, bezogen auf II, der Hilfsbase kann u.U. vorteilhaft sein.

Als Hilfsbase eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalicarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. Methylenchlorid, Diethylether, Toluol oder Essigsäureethylester verwendet werden.

40 Während der Zugabe des Säurechlorids wird die Reaktionsmischung vorzugsweise auf 0 bis 10°C gekühlt, danach wird bei einer Temperatur von 20 bis 100°C, insbesondere 25 bis 50°C gerührt, bis die Umsetzung beendet ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch in Wasser gegossen und das Wertprodukt extrahiert, z.B. mit Methylchlorid. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernung des Lösungsmittels kann der

45

5

rohe Enolester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden. Herstellungsbeispiele für Benzoyl-enolester von Cyclohexan-1,3-dione findet man z. B. in EP-A 186 118 oder US 4,780,127.

5

Die Umlagerung der Enolester zu den Verbindungen der Formel Ic erfolgt zweckmäßig bei Temperaturen von 20°C bis 40°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Hilfsbase sowie mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

10

Als Lösungsmittel kann z.B. Acetonitril, Methylenechlorid, 1,2-Dichlorethan, Essigsäureethylester oder Toluol verwendet werden. Bevorzugtes Lösungsmittel ist Acetonitril. Als Hilfsbase eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalicarbonate, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu vierfachem Überschuß, bezogen auf den Benzoylenolester, eingesetzt werden. Bevorzugte Hilfsbase ist Triethylamin in doppelter Menge.

15

Als Katalysator eignen sich z.B. Kaliumcyanid oder Acetoncyanhydrin, vorzugsweise in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Enolester. Bevorzugt setzt man Acetoncyanhydrin zu, z.B. in der Menge von 5 bis 15, insbesondere 10 Molprozent. Beispiele zur cyanidkatalysierten Umlagerung von Enolestern der Cyclohexan-1,3-dione findet man z.B. in EP-A 186 118 oder

25

US 4,780,127.

20

Die Aufarbeitung erfolgt in an sich bekannter Weise. Z.B. wird das Reaktionsgemisch mit verdünnten Mineralsäuren wie 5 %iger Salzsäure oder Schwefelsäure angesäuert und mit einem organischen Lösungsmittel wie Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert. Zur Reinigung wird der Extrakt mit kalter 5 bis 10 %iger Alkalicarbonatlösung extrahiert, wobei das Endprodukt in die wäßrige Phase übergeht. Durch Ansäuern der wäßrigen Lösung wird das Produkt der Formel IC ausgefällt oder erneut mit Methylenchlorid extrahiert, getrocknet und anschließend vom Lösungsmittel befreit.

30

Die als Ausgangsmaterial verwendeten 1,3-Diketone der Formeln II sind bekannt und können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A 71 707, EP-A 142 741, EP-A 243 313, US 4 249 937 und WO 92/13821). Cyclohexandion-1,3 und Dimedon sind käufliche Verbindungen.

35

Benzoësäurederivate der Formel III lassen sich folgendermaßen herstellen:

6

Benzoylhalogenide wie beispielsweise Benzoylchloride der Formel III (T = Cl) werden in an sich bekannter Weise durch Umsetzung der Benzoësäuren der Formel III (T = OH) mit Thionylchlorid hergestellt.

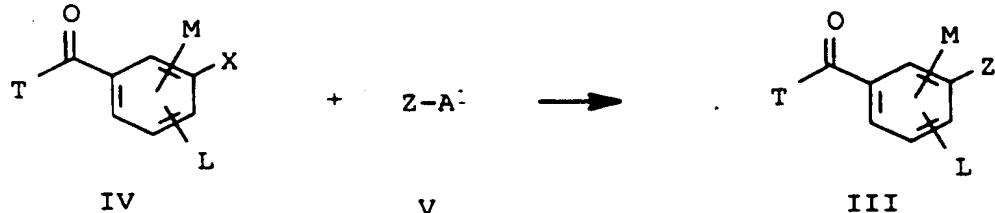
5

Die Benzoësäuren der Formel III (T = OH) können in bekannter Weise durch saure oder basische Hydrolyse aus den entsprechenden Estern der Formel III (T = C₁-C₄-Alkoxy) hergestellt werden.

10 Die Zwischenprodukte der Formel III lassen sich z.B. gemäß Schema 2 und 3 auf den im folgenden beschriebenen Wegen darstellen.

Schema 2

15



20

T C₁-C₄-Alkoxy,
 X Cl, Br, J, -OS(O)₂CF₃, -OS(O)₂F
 A⁻ Sn(C₁-C₄-Alkyl)₃, B(OH)₂, ZnHal, wobei Hal für Cl oder Br
 25 steht
 L, M, Z wie oben definiert.

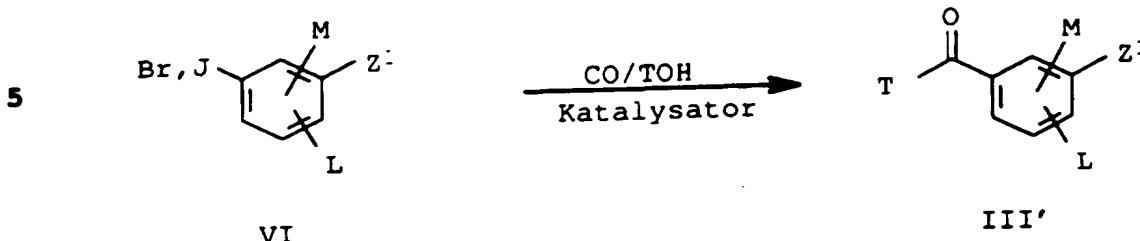
Danach lassen sich die Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonate IV in an sich bekannter Weise mit Heteroarylstannaten (Stille-Kupplungen), Heteroaryl-Borverbindungen (Suzuki-Kupplungen) oder Heteroaryl-Zinkverbindungen (Negishi-Reaktion) V (vgl. z.B. Synthesis 1987, 51-53, Synthesis 1992, 413) in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators und gegebenenfalls einer Base zu den neuen Verbindungen der allgemeinen Formel III umsetzen.

Die Benzoësäurederivate der Formel III können auch erhalten werden, indem man entsprechende brom- oder iodsubstituierte Verbindungen der Formel VI

40

45

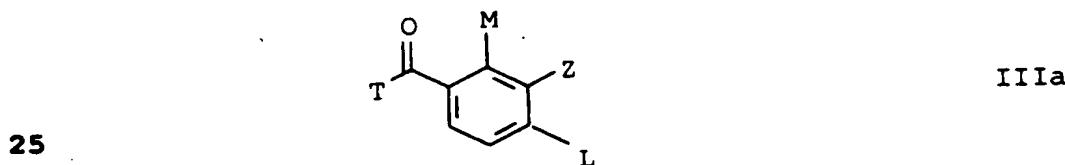
Schema 3



10 Z¹ Z oder CN
 T OH, C₁-C₄-Alkoxy

in der L und M die obengenannte Bedeutung haben, in Gegenwart
15 eines Palladium-, Nickel-, Cobalt- oder Rhodium-Übergangsmetall-
katalysators und einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser unter
erhöhtem Druck umsetzt.

Bevorzugt im Rahmen der vorliegenden Erfindung sind Benzoylderivate der Formel IIIa



in der T, L, M und Z die folgende Bedeutung haben:

30 T Chlor, OH oder C₁-C₄-Alkoxy
L C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy,
 C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro
 oder Cyano

35 M C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy,
 C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro
 oder Cyano

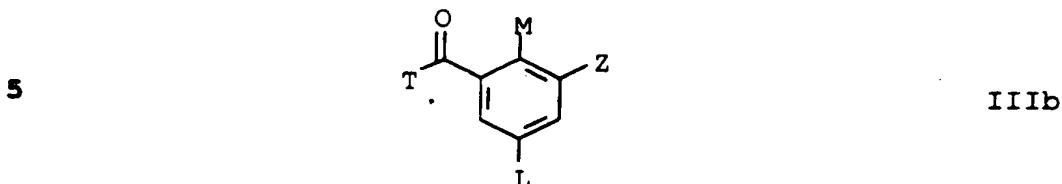
Z wie oben angegeben.

40

45

8

Bevorzugt sind auch Benzoylederivate der Formel IIIb



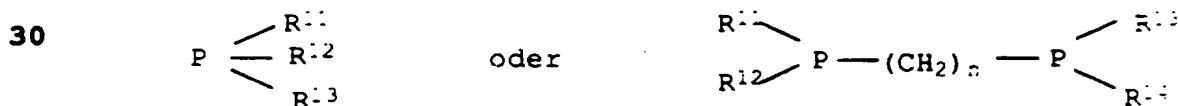
in der T,L,M und Z die folgende Bedeutung haben:

10 T Chlor, OH oder C₁-C₄-Alkoxy
L,M C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy,
 C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
 C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro
 oder Cyano

15 Z wie oben angegeben.

Die Katalysatoren Nickel, Cobalt, Rhodium und insbesondere Palladium können metallisch oder in Form üblicher Salze wie in Form von Halogenverbindungen, z.B. $PdCl_2$, $RhCl_3 \cdot H_2O$, Acetaten,

20 z.B. $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, Cyaniden usw. in den bekannten Wertigkeitsstufen vorliegen. Ferner können Metallkomplexe mit tertiären Phosphinen, Metallalkylcarbonyle, Metallcarbonyle, z.B. $\text{CO}_2(\text{CO})_8$, $\text{Ni}(\text{CO})_4$, Metallcarbonyl-Komplexe mit tertiären Phosphinen, z.B. $(\text{PPh}_3)_2\text{Ni}(\text{CO})_2$, oder mit tertiären Phosphinen komplexierte Übergangsmetallsalze vorliegen. Die letztgenannte Ausführungsform ist insbesondere im Fall von Palladium als Katalysator bevorzugt. Dabei ist die Art der Phosphinliganden breit variabel. Beispielsweise lassen sie sich durch folgende Formeln wiedergeben:



wobei n die Zahlen 1, 2, 3 oder 4 bedeutet und die Reste R¹ bis R⁴ für niedermolekulares Alkyl, z.B. C₁-C₆-Alkyl, Aryl,

35 C₁-C₆-Alkylaryl, z.B. Benzyl, Phenethyl oder Aryloxy stehen. Aryl ist z.B. Naphthyl, Anthryl und vorzugsweise gegebenenfalls substituiertes Phenyl, wobei man hinsichtlich der Substituenten nur auf deren Inertheit gegenüber der Carboxylierungsreaktion zu achten hat, ansonsten können sie breit variiert werden und umfassen

40 alle inerten C-organischen Reste wie C₁-C₆-Alkylreste, z.B. Methyl, Carboxylreste wie COOH, COOM (M ist z.B. ein Alkali-, Erdalkalimetall oder Ammoniumsalz), oder C-organische Reste über Sauerstoff gebunden wie C₁-C₆-Alkoxyreste.

45 Die Herstellung der Phosphinkomplexe kann in an sich bekannter Weise, z.B. wie in den eingangs genannten Dokumenten beschrieben, erfolgen. Beispielsweise geht man von üblichen kommerziell

9

erwerblichen Metallsalzen wie $PdCl_2$ oder $Pd(OCOCH_3)_2$ aus und fügt das Phosphin z.B. $P(C_6H_5)_3$, $P(n-C_4H_9)_3$, $PCH_3(C_6H_5)_2$, 1,2-Bis(diphenylphosphino)ethan hinzu.

5 Die Menge an Phosphin, bezogen auf das Übergangsmetall, beträgt üblicherweise 0 bis 20, insbesondere 0,1 bis 10 Moläquivalente, besonders bevorzugt 1 bis 5 Moläquivalente.

Die Menge an Übergangsmetall ist nicht kritisch. Natürlich wird 10 man aus Kostengründen eher eine geringe Menge, z.B. von 0,1 bis 10 Mol.-%, insbesondere 1 bis 5 Mol.-%, bezogen auf den Ausgangsstoff II bzw. III verwenden.

Zur Herstellung der Benzoesäuren III ($T = OH$) führt man die 15 Umsetzung mit Kohlenmonoxid und mindestens äquimolaren Mengen an Wasser, bezogen auf die Ausgangsstoffe VI durch. Der Reaktionspartner Wasser kann gleichzeitig auch als Lösungsmittel dienen, d.h. die maximale Menge ist nicht kritisch.

20 Es kann aber auch je nach Art der Ausgangsstoffe und der verwendeten Katalysatoren von Vorteil sein, anstelle des Reaktionspartners ein anderes inertes Lösungsmittel oder die für die Carboxylierung verwendete Base als Lösungsmittel zu verwenden.

25 Als inerte Lösungsmittel kommen für Carboxylierungsreaktionen übliche Lösungsmittel wie Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Hexan, Pentan, Cyclohexan, Ether z.B. Methyl-tert.butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dimethoxyethan, substituierte Amide wie Dimethylformamid, persubstituierte Harnstoffe wie 30 Tetra-C₁-C₄-alkylharnstoffe oder Nitrile wie Benzonitril oder Acetonitril in Betracht.

In einer bevorzugten Ausführungsform des Verfahrens verwendet man einen der Reaktionspartner, insbesondere die Base, im Überschuß, 35 so daß kein zusätzliches Lösungsmittel erforderlich ist.

Für das Verfahren geeignete Basen sind alle inerten Basen, die bei der Umsetzung freiwerdenden Jodwasserstoff bzw. Bromwasserstoff zu binden vermögen. Beispielsweise sind hier tertiäre 40 Amine wie tert.-Alkylamine, z.B. Trialkylamine wie Triethylamin, cyclische Amine wie N-Methylpiperidin oder N,N'-Dimethyl-piperazin, Pyridin, Alkali- oder -hydrogencarbonate, oder tetra-alkylsubstituierte Harnstoffderivate wie Tetra-C₁-C₄-alkyl-harnstoff, z.B. Tetramethylharnstoff, zu nennen.

10

Die Menge an Base ist nicht kritisch, üblicherweise werden 1 bis 10, insbesondere 1 bis 5 Mol verwendet. Bei gleichzeitiger Verwendung der Base als Lösungsmittel, wird die Menge in der Regel so bemessen, daß die Reaktionspartner gelöst sind, wobei man aus 5 Praktikabilitätsgründen unnötig hohe Überschüsse vermeidet, um Kosten zu sparen, kleine Reaktionsgefäße einsetzen zu können und den Reaktionspartnern maximalen Kontakt zu gewährleisten.

Während der Umsetzung wird der Kohlenmonoxiddruck so eingestellt, 10 daß immer ein Überschuß an CO, bezogen auf VI vorliegt. Vorzugsweise liegt der Kohlenmonoxiddruck bei Raumtemperatur bei 1 bis 250 bar, insbesondere 5 bis 150 bar CO.

Die Carbonylierung wird in der Regel bei Temperaturen von 20 bis 15 250°C, insbesondere bei 30 bis 150°C kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt. Bei diskontinuierlichem Betrieb wird zweckmäßigerweise zur Aufrechterhaltung eines konstanten Druckes kontinuierlich Kohlenmonoxid auf das Umsetzungsgemisch aufgepreßt.

20

Die als Ausgangsverbindungen benutzten Arylhalogenverbindungen VI sind bekannt oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

25 Beispielsweise können die Halogenverbindungen VI durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden, die ihrerseits durch Reduktion von geeigneten Nitroverbindungen (vgl. z.B. für VI mit $Z = CN$: Liebigs Ann. Chem. 1980, 768-778) synthetisiert werden. Die Arylbromide VI können außerdem durch direkte 30 Bromierung geeigneter Ausgangsverbindungen erhalten werden [vgl. z.B. Monatsh. Chem. 99, 815-822 (1968)].

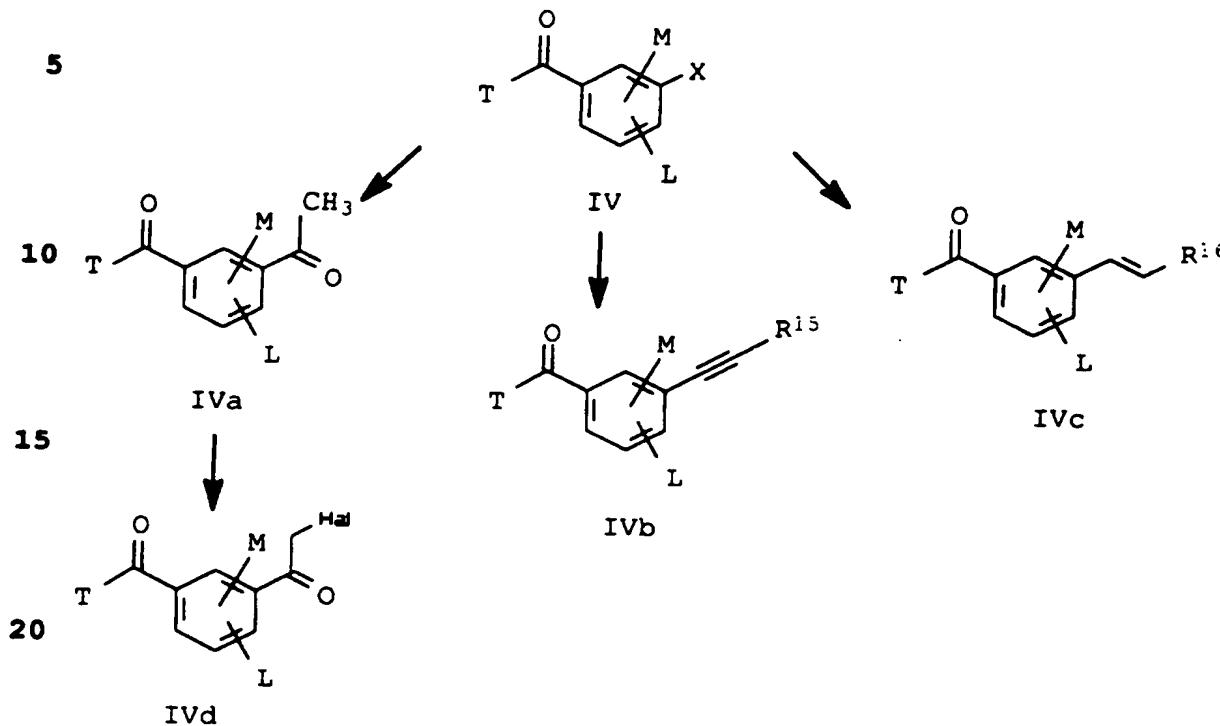
35

40

45

11

Schema 4



T C₁-C₄-Alkoxy

25 X Cl, Br, J, -OS(O)₂CF₃, -OS(O)₂F

L, M, Z wie oben definiert

R¹⁵ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cyclo-

alkyl, ggf. subst. Phenyl oder Trimethylsilyl,

R¹⁶ Wasserstoff, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder

ggf. subst. Phenyl.

Ausgehend von den Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten IV lassen sich in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators und gegebenenfalls einer Base Arylmethylketone IVa nach literaturbekannten Verfahren durch Umsetzung mit Vinylalkylethern und anschließende Hydrolyse herstellen [vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 32, 1753-1756 (1991)].

Die ethinylierten Aromaten IVb können in an sich bekannter Weise durch Umsetzung von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten IV mit substituierten Acetylenen in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators hergestellt werden (z.B. Heterocycles, 24, 31-32 (1986)). Derivate IVb mit R¹⁵=H erhält man zweckmäßigerweise aus den Silylverbindungen IVb, R¹⁵=-Si(CH₃)₃ [J.Org.Chem. 46, 2280-2286 (1981)].

12

12

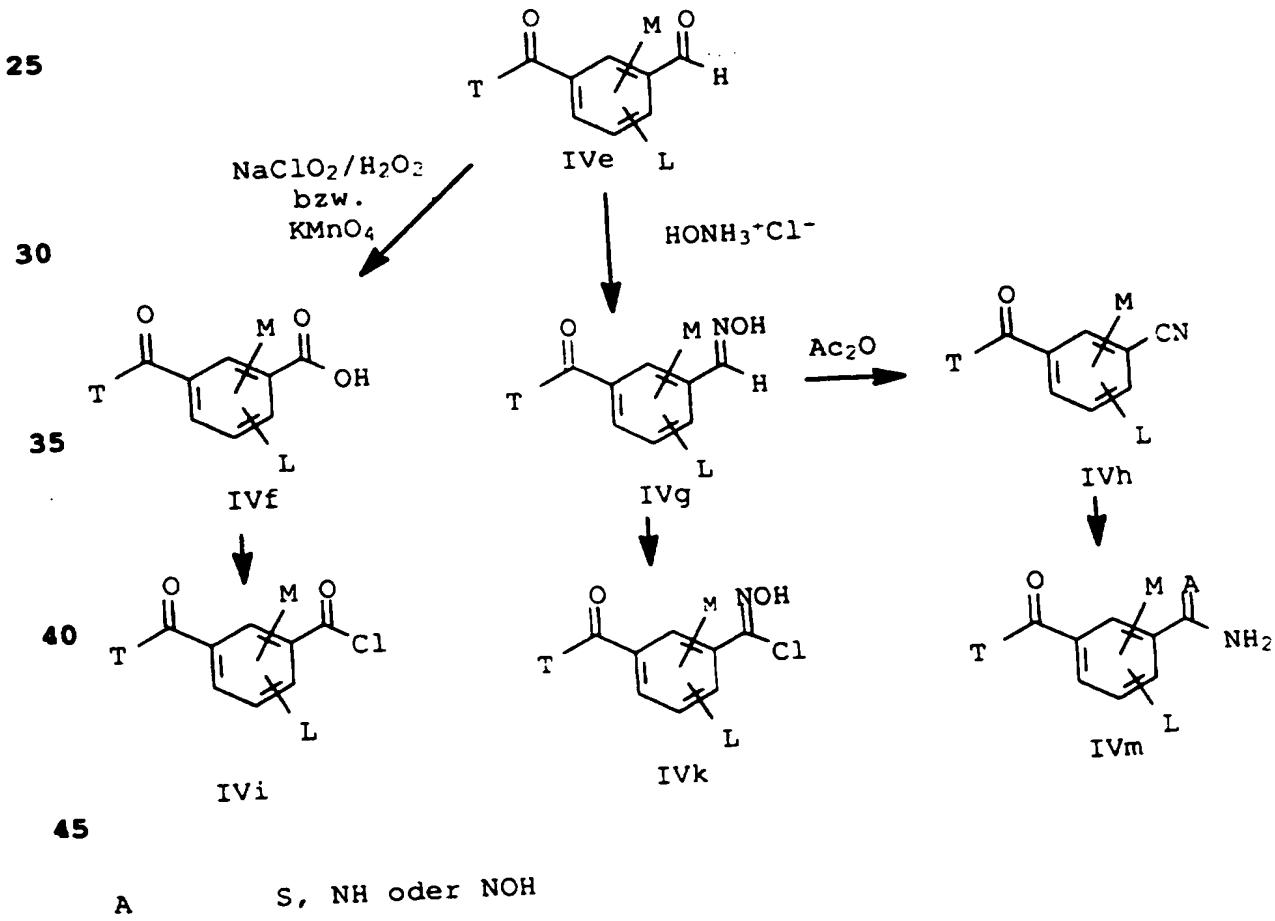
Durch Heck-Reaktion von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten IV mit Olefinen in Gegenwart eines Palladiumkatalysators werden die Arylalkene IVC erhalten (vgl. z.B. Heck, Palladium Reagents in Organic Synthesis, Academic Pres, London 1985 bzw. Synthesis 1993, 735-762).

Die als Ausgangsverbindungen benutzten Benzoylderivate IV sind bekannt [vgl. z.B. Coll. Czech. Chem. Commn. 40, 3009-3019 (1975)] oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

Beispielsweise können die Sulfonate IV ($X = -OS(O)_2CF_3$, $-OS(O)_2F$) aus den entsprechenden Phenolen, die ihrerseits bekannt sind (vgl. z.B. EP 195247) oder nach bekannten Methoden hergestellt werden können, erhalten werden (vgl. z.B. Synthesis 1993, 735-762).

Die Halogenverbindungen IV ($X = Cl$, Br oder I) können beispielsweise durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden.

Schema 5



13

T ist C₁-C₆-Alkoxy und L, M wie oben definiert.

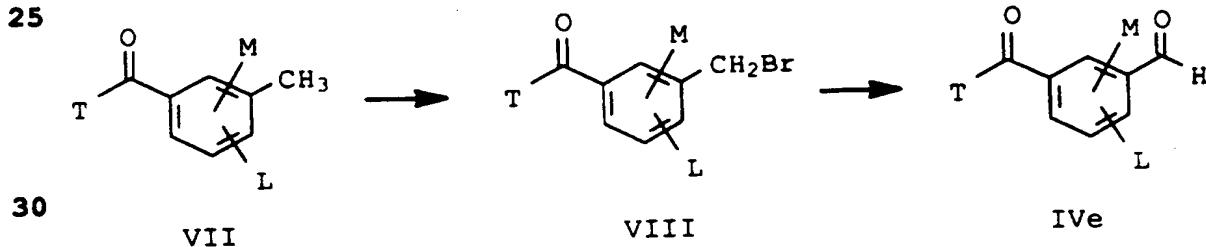
Isophthalsäurederivate IVf können aus den Aldehyden IVe nach bekannten Verfahren hergestellt werden [s. J. March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 629ff, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die Oxime IVg erhält man vorteilhaft dadurch, daß man in an sich bekannter Weise Aldehyde IVe mit Hydroxylamin umsetzt [s. J. March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die Umwandlung der Oxime IVg in Nitrile IVh kann ebenfalls nach an sich bekannten Verfahren erfolgen [s. J. March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 931-932, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die als Ausgangsverbindungen benötigten Aldehyde IVe sind bekannt oder nach bekannten Methoden herstellbar. Beispielsweise können sie gemäß Schema 6 aus den Methylverbindungen VII synthetisiert werden.

Schema 6



Die Reste T, M und L haben die unter Schema 5 genannte Bedeutung. Die Methylverbindungen VII können nach allgemein bekannten Methoden, beispielsweise mit N-Bromsuccinimid oder 1,3-Dibrom-5,5-dimethylhydantoin, zu den Benzylbromiden VIII umgesetzt werden. Die Umsetzung von Benzylbromiden zu Benzaldehyden IVe ist ebenfalls literaturbekannt [vgl. Synth. Commun. 22 1967-1971 (1992)].

40 Die Vorprodukte IVa bis IVh eignen sich zum Aufbau heterocyclischer Zwischenprodukte III.

Beispielsweise können aus den Acetophenonen IVa über die halogenierte Zwischenstufe IVd 5-Oxazolyl-[vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] oder 4-Thiazolyl-derivate [vgl.

14

z.B. Metzger, Thiazoles in: The Chemistry of heterocyclic compounds, Vol.34 S. 175ff (1976)] erhalten werden.

Die Acetylene IVb bzw. die Alkene IVc eignen sich zum Aufbau von 5 4-Isoxazolyl-, 5-Isoxazolyl-, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl-, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl-derivaten [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/3, S. 843ff (1965)].

Aus den Benzoesäuren IVf bzw. den daraus nach Standardverfahren 10 erhältlichen Säurechloriden IVi können beispielsweise nach literaturbekannten Verfahren 2-Oxazolyl-, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl-, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl-derivate [vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] oder 2-Pyrrolyl-derivate [vgl. z.B. Heterocycles 26, 3141-3151 (1987)] hergestellt werden.

15

1,2,4-Triazol-3-yl-derivate sind aus Benzonitrilen IVh nach bekannten Methoden [vgl. z.B. J. Chem. Soc. 3461-3464 (1954)] herzustellen.

20 Die Benzonitrile IVh können über die Zwischenstufe der Thioamide, Amidoxime oder Amdine IVm in 1,2,4-Oxadiazol-3-yl- [vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] 2-Thiazolyl-, 4,5-Dihydro-thiazol-2-yl- oder 5,6-Dihydro-4-H-1,3-thiazin-2-yl-derivate [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4.

25 25 Aufl., Bd. E5, S. 1268ff (1985)] umgewandelt werden. Aus den Thioamiden IVm ($A=S$) sind nach literaturbekannten Verfahren auch 1,2,4-Thiadiazol-5-yl-derivate [vgl. z.B. J.Org.Chem. 45 3750-3753 (1980)] oder 1,3,4-Thiadiazol-2-yl-derivate [vgl. z.B. J. Chem.Soc., Perkin Trans. I 1987-1991 (1982)] erhältlich.

30

Die Umwandlung von Oximen IVg in 3-Isoxazolyl-derivate kann in an sich bekannter Weise über die Zwischenstufe der Hydroxamsäure-chloride IVk erfolgen [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/3, S. 843ff (1965)].

35

Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Benzyldervate der allgemeinen Formel I kommen als Substituenten folgende Reste in Betracht:

40 L,M Wasserstoff,

C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 45 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl,

15

2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder 1-Ethyl-2-methyl-propyl,

5 insbesondere Methyl, Ethyl, 1-Methylethyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl und 1,1-Dimethylpropyl:

C₂-C₆-Alkenyl wie 2-Propenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl,

10 4-Pentenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-4-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl,

15 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl,

20 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl und Ethyl-2-methyl-2-propenyl,

25

insbesondere 1-Methyl-2-propenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl und 1,1-Dimethyl-2-butenyl;

C₇-C₆-Alkinyl wie Propargyl, 2-Butinyl, 3-Butenyl, 2-Pentinyl,

30 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl,

35 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, n-Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy,

insbesondere C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy,

16

wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch ein bis fünf Halogenatome wie Fluor, Chlor, Brom und Iod, vorzugsweise Fluor und Chlor oder C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt substituiert sein können.

5

Die vorstehend definierte Gruppe -(Y)_n-S(O)_mR' steht beispielsweise für

C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, 1-Methyl-10 ethylthio, n-Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio, insbesondere Methylthio;

C₁-C₄-Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n-Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, n-Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 15 2-Methylpropylsulfinyl und 1,1-Dimethylethylsulfinyl, insbesondere Methylsulfinyl;

C₁-C₄-Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n-Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, n-Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 20 2-Methylpropylsulfonyl und 1,1-Dimethylethylsulfonyl, insbesondere Methylsulfonyl;

C₁-C₄-Alkoxsulfonyl wie Methoxysulfonyl, Ethoxysulfonyl, n-Propoxy-25 sulfonyl, 1-Methylethoxysulfonyl, n-Butoxysulfonyl, 1-Methylpropoxysulfonyl, 2-Methylpropoxysulfonyl und 1,1-Dimethylethoxy-sulfonyl, insbesondere Methoxysulfonyl;

N-C₁-C₄-Alkylsulfamoyl wie N-Methylsulfamoyl, N-Ethylsulfamoyl, N-n-Propylsulfamoyl, N-1-Methylethylsulfamoyl, N-n-Butylsulfamoyl, 30 N-1-Methylpropylsulfamoyl, N-2-Methylpropylsulfamoyl und N-1,1-Dimethylethylsulfamoyl, insbesondere N-Methylsulfamoyl; N-C₁-C₄-Alkylsulfinamoyl wie N-Methylsulfinamoyl, N-Ethylsulfinamoyl, N-n-Propylsulfinamoyl, N-1-Methylethylsulfinamoyl, N-n-Butylsulfinamoyl, N-1-Methylpropylsulfinamoyl, N-2-Methylpropylsulfinamoyl und 35 N-1,1-Dimethylethylsulfinamoyl, insbesondere N-Methylsulfinamoyl;

Di-C₁-C₄-Alkylsulfamoyl wie Dimethylsulfamoyl, Diethylsulfamoyl, Dipropylsulfamoyl, Dibutylsulfamoyl, N-Methyl-N-ethylsulfamoyl, 40 N-Methyl-N-propylsulfamoyl, N-Methyl-N-1-methylethylsulfamoyl, N-Methyl-N-1,1-Dimethylethylsulfamoyl, Di-1-Methylethylsulfamoyl, N-Ethyl-N-1-Methylethylsulfamoyl und N-Ethyl-N-1,1-dimethylethylsulfamoyl; insbesondere Dimethylsulfamoyl;

45 Di-C₁-C₄-Alkylsulfinamoyl wie Dimethylsulfinamoyl, Diethylsulfinamoyl, Dipropylsulfinamoyl, Dibutylsulfinamoyl, N-Methyl-N-ethylsulfinamoyl, N-Methyl-N-propylsulfinamoyl, N-Methyl-N-1-methyl-

17

ethylsulfinamoyl, N-Methyl-N-1,1-Dimethylethylsulfinamoyl,
Di-1-Methylethylsulfinamoyl, N-Ethyl-N-1-Methylethylsulfinamoyl
und N-Ethyl-N-1,1-dimethyl ethylsulfinamoyl; insbesondere Dime-
thylsulfinamoyl,

5

C₁-C₄-Alkylsulfinyloxy wie Methylsulfinyloxy, Ethylsulfinyloxy,
n-Propylsulfinyloxy, 1-Methylethylsulfinyloxy, n-Butylsulfiny-
loxy, 1-Methylpropylsulfinyloxy, 2-Methylpropylsulfinyloxy und
1,1-Dimethylethylsulfinyloxy, insbesondere Methylsulfinyloxy;

10

C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy wie Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy,
n-Propylsulfonyloxy, 1-Methylethylsulfonyloxy, n-Butylsulfony-
loxy, 1-Methylpropylsulfonyloxy, 2-Methylpropylsulfonyloxy und
1,1-Dimethylethylsulfonyloxy, insbesondere Methylsulfonyloxy;

15

C₁-C₄-Alkylsulfinylamino wie Methylsulfinylamino, Ethylsulfinyl-
amino, n-Propylsulfinylamino, 1-Methylethylsulfinylamino, n-Bu-
tylsulfinylamino, 1-Methylpropylsulfinylamino, 2-Methylpropylsul-
finylamino und 1,1-Dimethylethylsulfinylamino, insbesondere Me-
thylosulfinylamino;

20

C₁-C₄-Alkylsulfonylamino wie Methylsulfonylamino, Ethylsulfonyl-
amino, n-Propylsulfonylamino, 1-Methylethylsulfonylamino, n-Bu-
tylsulfonylamino, 1-Methylpropylsulfonylamino, 2-Methylpropylsul-
fonylamino und 1,1-Dimethylethylsulfonylamino, insbesondere
Methylsulfonylamino;

25

N-C₁-C₄-Alkylsulfinyl-N-methyl-amino wie N-Methylsulfinyl-N-me-
thyl-amino, N-Ethylsulfinyl-N-methyl-amino, N-n-Propylsulfinyl-N-
methyl-amino, N-1-Methylethylsulfinyl-N-methyl-amino, N-n-Butyl-
sulfinyl-N-methyl-amino, N-1-Methylpropylsulfinyl-N-methyl-amino,
N-2-Methylpropylsulfinyl-N-methyl-amino und N-1,1-Dimethylethyl-
sulfinyl-N-methyl-amino, insbesondere N-Methylsulfinyl-N-methyl-
amino;

35

N-C₁-C₄-Alkylsulfinyl-N-ethyl-amino wie N-Methylsulfinyl-N-ethyl-
amino, N-Ethylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-n-Propylsulfinyl-N-ethyl-
amino, N-1-Methylethylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-n-Butylsulfinyl-
N-ethyl-amino, N-1-Methylpropylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-2-Me-
thylpropylsulfinyl-N-ethyl-amino und N-1,1-Dimethylethylsulfinyl-
N-ethyl-amino, insbesondere N-Methylsulfinyl-N-ethyl-amino;

45

N-C₁-C₄-Alkylsulfonyl-N-methyl-amino wie N-Methylsulfonyl-N-me-
thyl-amino, N-Ethylsulfonyl-N-methyl-amino, N-n-Propylsulfonyl-N-
methyl-amino, N-1-Methylethylsulfonyl-N-methyl-amino, N-n-Butyl-
sulfonyl-N-methyl-amino, N-1-Methylpropylsulfonyl-N-methyl-amino,
N-2-Methylpropylsulfonyl-N-methyl-amino und N-1,1-Dimethylethyl-

18

sulfonyl-N-methyl-amino, insbesondere N-Methylsulfonyl-N-methyl-amino;

5 N-C₁-C₄-Alkylsulfonyl-N-ethyl-amino wie N-Methylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-Ethylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-n-Propylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-1-Methylethylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-n-Butylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-1-Methylpropylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-2-Methylpropylsulfonyl-N-ethyl-amino und N-1,1-Dimethylethylsulfonyl-N-ethyl-amino, insbesondere N-Methylsulfonyl-N-ethyl-amino;

10

C₁-C₄-Halogenalkylthio wie Chloromethylthio, Dichloromethylthio, Trichloromethylthio, Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluoromethylthio, Chlorfluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, **15** 2,2,2-Trifluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2 fluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio und Pentafluorethylthio, insbesondere Trifluormethylthio.

Die vorstehend definierte Gruppe -(Y)_r-CO-R⁸ steht beispielsweise **20** für

C₁-C₄-Alkylcarbonyl wie Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, 1-Methylethylcarbonyl, n-Butylcarbonyl, 1-Methylpropylcarbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl und 1,1-Dimethylethylcarbonyl, **25** insbesondere Methylcarbonyl;

30 C₁-C₄-Alkoxy carbonyl wie Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, n-Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl und 1,1-Dimethylethoxy carbonyl, insbesondere Methoxycarbonyl; -

35 N-C₁-C₄-Alkylcarbamoyl wie N-Methylcarbamoyl, N-Ethylcarbamoyl, N-n-Propylcarbamoyl, N-1-Methylethylcarbamoyl, N-n-Butylcarbamoyl, N-1-Methylpropylcarbamoyl, N-2-Methylpropylcarbamoyl und N-1,1-Dimethylethylcarbamoyl, insbesondere N-Methylcarbamoyl;

40 Di-C₁-C₄-Alkylcarbamoyl wie Dimethylcarbamoyl, Diethylcarbamoyl, Dipropylcarbamoyl, Dibutylcarbamoyl, N-Methyl-N-ethylcarbamoyl, N-Methyl-N-propylcarbamoyl, N-Methyl-N-1-methylethylcarbamoyl, N-Ethyl-N-1,1-Dimethylethylcarbamoyl, Di-1-Methylethylcarbamoyl, N-Ethyl-N-1-Methylethylcarbamoyl und N-Ethyl-N-1,1-dimethyl ethylcarbamoyl; insbesondere Dimethylcarbamoyl;

45 C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy wie Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, n-Propylcarbonyloxy, 1-Methylethylcarbonyloxy, n-Butylcarbonyloxy, 1-Methylpropylcarbonyloxy, 2-Methylpropylcarbonyloxy und 1,1-Dimethylethylcarbonyloxy, insbesondere Methylcarbonyloxy;

19

C₁-C₄-Alkylcarbonylamino wie Methylcarbonylamino, Ethylcarbonylamino, n-Propylcarbonylamino, 1-Methylethylcarbonylamino, n-Butylcarbonylamino, 1-Methylpropylcarbonylamino, 2-Methylpropylcarbonylamino und 1,1-Dimethylethylcarbonylamino, insbesondere Methyl-

5 carbonylamino;

N-C₁-C₄-Alkylcarbonyl-N-methyl-amino wie N-Methylcarbonyl-N-methyl-amino, N-Ethylcarbonyl-N-methyl-amino, N-n-Propylcarbonyl-N-methyl-amino, N-1-Methylethylcarbonyl-N-methyl-amino, N-n-Butyl-

10 carbonyl-N-methyl-amino, N-1-Methylpropylcarbonyl-N-methyl-amino, N-2-Methylpropylcarbonyl-N-methyl-amino und N-1,1-Dimethylethylcarbonyl-N-methyl-amino, insbesondere N-Methylcarbonyl-N-methyl-amino.

15 Z steht beispielsweise für:

5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, beispielsweise

20 fünfring Heteroaromaten wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Iothiazolyl, 4-Iothiazolyl, 5-Iothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl,

25 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,2,3-Oxadiazol-4-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl, 1,2,5-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl, 1,2,3-Thiadiazol-4-yl, 1,2,3-Thiadiazol-5-yl,

30 1,2,5-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Triazol-2-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-5-yl, Tetrazol-5-yl, insbesondere 2-Thiazolyl und 3-Isoxazolyl;

35 sechsring Heteroaromaten wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-6-yl, 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl;

40 5- bis 6-gliedrige, gesättigte oder teilweise ungesättigte Heterocyclen, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein oder zwei Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuran, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-4-yl, 1-3-Dithian-2-yl, 1,3-Dithian-4-yl, 5,6-Dihydro-4H-1,3-

20

thiazin-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl,
 1-Pyrrolidinyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl,
 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Iothiazolidinyl, 4-Iso-
 thiazolidinyl, 5-Iothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl,
5 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl,
 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl,
 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxa-
 diazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazia-
 zolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,3,4-Oxadia-
10 zolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl,
 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl, 2,4-Dihydro-
 fur-2-yl, 2,4-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydro-
 thien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl,
 2,3-Pyrrolin-2-yl, 2,3-Pyrrolin-3-yl, 2,4-Pyrrolin-2-yl,
15 2,4-Pyrrolin-3-yl, 2,3-Isoxazolin-3-yl, 3,4-Isoxazolin-3-yl,
 4,5-Isoxazolin-3-yl, 2,3-Isoxazolin-4-yl, 3,4-Isoxazolin-4-yl,
 4,5-Isoxazolin-4-yl, 2,3-Isoxazolin-5-yl, 3,4-Isoxazolin-5-yl,
 4,5-Isoxazolin-5-yl, 2,3-Iothiazolin-3-yl, 3,4-Iothiazolin-3-yl,
 4,5-Iothiazolin-3-yl, 2,3-Iothiazolin-4-yl, 3,4-Iothia-
20 zolin-4-yl, 4,5-Iothiazolin-4-yl, 2,3-Iothiazolin-5-yl,
 3,4-Iothiazolin-5-yl, 4,5-Iothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyra-
 zol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl,
 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropy-
 razol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl,
25 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropy-
 razol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl,
 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxa-
 zol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Di-
 hydrooxazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-5-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
30 1,3-Dioxolan-4-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl,
 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 3-Tetrahydropyrida-
 zinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl, 2-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetra-
 hydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl,
 1,3,5-Tetrahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl,
35 insbesondere 2-Tetrahydrofuranyl, 1,3-Dioxolan-2-yl und
 1,3-Dioxan-2-yl,

der gegebenenfalls durch

40 Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor oder Chlor,

Cyano, Nitro,

eine Gruppe -COR⁸, beispielsweise Alkylcarbonyl wie vorstehend ge-
45 nannt, Alkoxy carbonyl wie vorstehend genannt, N-Alkylcarbamoyl
 wie vorstehend genannt, Dialkylcarbamoyl wie vorstehend genannt;

21

C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt,

C₁-C₄-Halogenalkyl wie beispielsweise Chlormethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluor-
 5 methyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-1,1,2-tri-
 fluorethyl und Pentafluorethyl, Decafluorbutyl, 1,1-Bis-trifluor-
 methyl-2,2,2-trifluorethyl, bevorzugt Difluormethyl, Trifluor-
 methyl, Trichlormethyl und Chlordifluormethyl;

10

C₃-C₈-Cycloalkyl, wie beispielsweise Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, insbesondere Cyclopropyl und Cyclohexyl;

15 C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt,

C₁-C₄-Halogenalkoxy wie beispielsweise Chlormethoxy, Dichlor-
 methoxy, Trichlormethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluor-
 methoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, 1-Fluormeth-
 20 oxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy,
 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Penta-
 fluorethoxy, insbesondere C₁-C₃-Halogenalkoxy wie 2,2,2-Trifluor-
 ethoxy und 2-Chlor-2,2-difluorethoxy;

25 C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt,

C₁-C₄-Halogenalkylthio wie vorstehend genannt,

Di-C₁-C₄-Alkylamino wie beispielsweise Dimethylamino, Diethyl-
 30 amino, Dipropylamino, Dibutylamino, N-Methyl-N-ethylamino, N-Me-
 thyl-N-propylamino, N-Methyl-N-1-methylethylamino, N-Me-
 thyl-N-1,1-Dimethylethylamino, Di-1-Methylethylamino, N-
 Ethyl-N-1-methylethylamino und N-Ethyl-N-1,1-dimethyl ethylamino;

35 gegebenenfalls substituiertes Phenyl

oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist, beispielsweise Thiazolin-4,5-dion-2-yl, 3-Oxo-3H-1,2,4-dithiazolyl

40 oder 2-Oxo-2H-1,3,4-dithiazolyl.

Benzokondensierte 5- oder 6-Ring-Heteroaromatens sind beispielsweise Benzofuranyl, Benzothienyl, Indolyl, Benzoxazolyl, Benzisoxazolyl, Benzthiazolyl, Benzisothiazolyl, Benzpyrazolyl,
 45 Indazolyl, 1,2,3-Benzothiadiazolyl, 2,1,3-Benzothiadiazolyl, Benzotriazolyl, Benzofuroxanyl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Cinnolinyl, Chinazolinyl, Chinoxalinyl oder Phthalazinyl. Bei-

22

spiele für besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind in den folgenden Tabellen 1 bis 5 zusammengestellt.

5

10

15

20

25

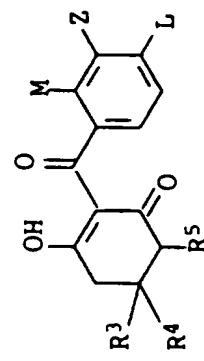
30

35

40

45

Tabelle 1: Verbindungen der Struktur Id



NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.12	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1.13	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1.14	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1.15	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1.16	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.17	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.18	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.19	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.20	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.21	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.22	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.23	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
1.24	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.25	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl	
1.26	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-2-pyrrolyl	
1.27	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	
1.28	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiaazolyl	
1.29	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl	
1.30	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methylbenzimidazol-2-yl	
1.31	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Oxazolyl	
1.32	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	
1.33	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-3-yl	
1.34	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-5-yl	
1.35	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethylpyrazol-3-yl	
1.36	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	
1.37	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,4-Dimethylpyrazol-5-yl	
1.38	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethylpyrazol-4-yl	
1.39	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,5-Dimethylpyrazol-4-yl	
1.40	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-4-yl	
1.41	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethylpyrazol-5-yl	
1.42	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl	
1.43	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methylthio-thiazol-2-yl	
1.44	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methoxy-1-methylpyrazol-5-yl	
1.45	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Cyclopropylisoxazol-5-yl	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.46	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isopropylisoxazol-5-yl
1.47	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1.48	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-thiazol-2-yl
1.49	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Brom-2-thienyl
1.50	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-2-thienyl
1.51	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-2-thienyl
1.52	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-1-thiazol-2-yl
1.53	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Chlor-thiazol-2-yl
1.54	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dimethylthiazol-2-yl
1.55	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1.56	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1.57	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-2-pyridyl
1.58	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.59	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methylthio-2-pyridyl
1.60	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methoxy-3-pyridyl
1.61	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methoxy-2-pyridyl
1.62	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methyl-2-pyridyl
1.63	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.64	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.65	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidiny
1.66	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Dimethylamino-3-pyridyl

NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	N	Z
1.67	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	
1.68	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl	
1.69	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	
1.70	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyrimidinyl	
1.71	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	
1.72	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	
1.73	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	
1.74	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	
1.75	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-oxazol-2-yl	
1.76	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-oxazol-2-yl	
1.77	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methyl-oxazol-5-yl	
1.78	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Phenyl-oxazol-5-yl	
1.79	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Phenyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl	
1.80	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.81	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.82	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.83	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	
1.84	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	
1.85	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyano-4,5-dihydro-isoxazol-3-yl	
1.86	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	
1.87	H	H	SO ₂ CH ₃	C1		

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.88	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dithiolan-2-y1
1.89	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dioxolan-2-y1
1.90	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dithian-2-y1
1.91	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dioxan-2-y1
1.92	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Oxathiolan-2-y1
1.93	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Triazol-1-y1
1.94	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-y1
1.95	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-y1
1.96	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	Thiazolin-4,5-dion-2-y1
1.97	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Oxo-3-H-1,2,4-dithiazol-5-y1
1.98	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-y1
1.99	H	H	H	NO ₂	H	1-Pyrrolyl
1.100	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Pyrrolyl
1.101	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Pyrrolyl
1.102	H	H	H	NO ₂	H	3,5-Dimethyl-pyrazol-1-y1
1.103	H	H	H	NO ₂	C1	2-Thienyl
1.104	H	H	H	NO ₂	C1	3-Thienyl
1.105	H	H	H	NO ₂	C1	2-Furyl
1.106	H	H	H	NO ₂	C1	3-Furyl
1.107	H	H	H	NO ₂	C1	3-Methyl-isoxazol-5-y1
1.108	H	H	H	NO ₂	C1	5-Thiazolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.109	H	H	NO ₂	C1	4-Thiazolyl	
1.110	H	H	NO ₂	C1	2-Thiazolyl	
1.111	H	H	NO ₂	C1	3-Methyl-isothiazol-5-yl	
1.112	H	H	NO ₂	C1	3-Isoxazolyl	
1.113	H	H	NO ₂	C1	5-Phenyl-thiazol-2-yl	
1.114	H	H	NO ₂	C1	2-Pyridyl	
1.115	H	H	NO ₂	C1	3-Pyridyl	
1.116	H	H	NO ₂	C1	4-Pyridyl	
1.117	H	H	NO ₂	C1	1-Methyl-2-pyrrolyl	
1.118	H	H	NO ₂	C1	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	
1.119	H	H	NO ₂	C1	2-Benzthiazolyl	
1.120	H	H	NO ₂	C1	2-Chinolinyl	
1.121	H	H	NO ₂	C1	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	
1.122	H	H	NO ₂	C1	2-Oxazolyl	
1.123	H	H	NO ₂	C1	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	
1.124	H	H	NO ₂	C1	1-Methyl-pyrazol-3-yl	
1.125	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	
1.126	H	H	NO ₂	C1	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	
1.127	H	H	NO ₂	C1	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	
1.128	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	
1.129	H	H	NO ₂	C1		

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.130	H	H	H	NO ₂	C1	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-y1
1.131	H	H	H	NO ₂	C1	1-Methyl-pyrazol-4-y1
1.132	H	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-y1
1.133	H	H	H	NO ₂	C1	4-Methyl-oxazol-2-y1
1.134	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methylthio-thiazol-2-y1
1.135	H	H	H	NO ₂	C1	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-y1
1.136	H	H	H	NO ₂	C1	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-y1
1.137	H	H	H	NO ₂	C1	3-Isopropyl-isoxazol-5-y1
1.138	H	H	H	NO ₂	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-y1
1.139	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methyl-thiazol-2-y1
1.140	H	H	H	NO ₂	C1	4-Brom-2-thienyl
1.141	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methyl-2-thienyl
1.142	H	H	H	NO ₂	C1	4-Methyl-2-thienyl
1.143	H	H	H	NO ₂	C1	4-Methyl-thiazol-2-y1
1.144	H	H	H	NO ₂	C1	4-Chlor-thiazol-2-y1
1.145	H	H	H	NO ₂	C1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-y1
1.146	H	H	H	NO ₂	C1	4-Phenyl-thiazol-2-y1
1.147	H	H	H	NO ₂	C1	2-Methoxy-thiazol-5-y1
1.148	H	H	H	NO ₂	C1	4-Methyl-2-pyridyl
1.149	H	H	H	NO ₂	C1	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.150	H	H	H	NO ₂	C1	6-Methylthio-2-pyridyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.151	H	H	H	NO ₂	C1	6-Methoxy-3-pyridyl
1.152	H	H	H	NO ₂	C1	6-Methoxy-2-pyridyl
1.153	H	H	H	NO ₂	C1	6-Methyl-2-pyridyl
1.154	H	H	H	NO ₂	C1	6-(2,2,2-Trifluoroethoxy)-2-pyridyl
1.155	H	H	H	NO ₂	C1	6-(2,2,2-Trifluoroethoxy)-3-pyridyl
1.156	H	H	H	NO ₂	C1	5-Pyrimidinyl
1.157	H	H	H	NO ₂	C1	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.158	H	H	H	NO ₂	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.159	H	H	H	NO ₂	C1	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.160	H	H	H	NO ₂	C1	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.161	H	H	H	NO ₂	C1	2-Pyrimidinyl
1.162	H	H	H	NO ₂	C1	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.163	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.164	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.165	H	H	H	NO ₂	C1	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.166	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.167	H	H	H	NO ₂	C1	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.168	H	H	H	NO ₂	C1	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.169	H	H	H	NO ₂	C1	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.170	H	H	H	NO ₂	C1	2-Methyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
1.171	H	H	H	NO ₂	C1	2-Phenyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.172	H	H	H	NO ₂	C1	5-Trifluormethyl-1,2,4-Oxadiazol-3-y1
1.173	H	H	H	NO ₂	C1	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-y1
1.174	H	H	H	NO ₂	C1	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-y1
1.175	H	H	H	NO ₂	C1	5-Phenyl-isoxazol-3-y1
1.176	H	H	H	NO ₂	C1	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-y1
1.177	H	H	H	NO ₂	C1	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-y1
1.178	H	H	H	NO ₂	C1	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-y1
1.179	H	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dithiolan-2-y1
1.180	H	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dioxolan-2y1
1.181	H	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dithian-2-y1
1.182	H	H	H	NO ₂	C1	1,3-Dioxan-2-y1
1.183	H	H	H	NO ₂	C1	1,3-Oxathiolan-2-y1
1.184	H	H	H	NO ₂	C1	1,2,4-Triazol-1-y1
1.185	H	H	H	NO ₂	C1	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-y1
1.186	H	H	H	NO ₂	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-y1
1.187	H	H	H	NO ₂	C1	Thiazolin-4,5-dion-2-y1
1.188	H	H	H	NO ₂	C1	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-y1
1.189	H	H	H	NO ₂	C1	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-y1
1.190	H	H	H	C1	C1	2-Thienyl
1.191	H	H	H	C1	C1	3-Thienyl
1.192	H	H	H	C1	C1	2-Furyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.193	H	H	C1	C1	3-Furyl	
1.194	H	H	C1	C1	3-Methyl-isoxazol-5-y1	
1.195	H	H	C1	C1	5-Thiazolyl	
1.196	H	H	C1	C1	4-Thiazolyl	
1.197	H	H	C1	C1	2-Thiazolyl	
1.198	H	H	C1	C1	3-Methyl-isothiazol-5-y1	
1.199	H	H	C1	C1	5-Phenyl-thiazol-2-y1	
1.200	H	H	C1	C1	2-Pyridyl	
1.201	H	H	C1	C1	3-Pyridyl	
1.202	H	H	C1	C1	4-Pyridyl	
1.203	H	H	C1	C1	1-Methyl-2-pyrrolyl	
1.204	H	H	C1	C1	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-y1	
1.205	H	H	C1	C1	2-Benzthiazolyl	
1.206	H	H	C1	C1	2-Chinolinyl	
1.207	H	H	C1	C1	1-Methyl-benzimidazol-2-y1	
1.208	H	H	H	C1	2-Oxazolyl	
1.209	H	H	H	C1	1-Phenyl-pyrazol-5-y1	
1.210	H	H	H	C1	1-Methyl-pyrazol-3-y1	
1.211	H	H	H	C1	1-Methyl-pyrazol-5-y1	
1.212	H	H	H	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-y1	
1.213	H	H	H	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-y1	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.214	H	H	H	C1	C1	1-Phenyl-pyrazol-3-y1
1.215	H	H	H	C1	C1	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-y1
1.216	H	H	H	C1	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-y1
1.217	H	H	H	C1	C1	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-y1
1.218	H	H	H	C1	C1	1-Methyl-pyrazol-4-y1
1.219	H	H	H	C1	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-y1
1.220	H	H	H	C1	C1	4-Methyl-oxazol-2-y1
1.221	H	H	H	C1	C1	5-Methylthio-thiazol-2-y1
1.222	H	H	H	C1	C1	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-y1
1.223	H	H	H	C1	C1	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-y1
1.224	H	H	H	C1	C1	3-Isopropyl-isoxazol-5-y1
1.225	H	H	H	C1	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-y1
1.226	H	H	H	C1	C1	5-Methyl-thiazol-2-y1
1.227	H	H	H	C1	C1	4-Brom-2-thienyl
1.228	H	H	H	C1	C1	5-Methyl-2-thienyl
1.229	H	H	H	C1	C1	4-Methyl-2-thienyl
1.230	H	H	H	C1	C1	4-Methyl-thiazol-2-y1
1.231	H	H	H	C1	C1	4-Chlor-thiazol-2-y1
1.232	H	H	H	C1	C1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-y1
1.233	H	H	H	C1	C1	4-Phenyl-thiazol-2-y1
1.234	H	H	H	C1	C1	2-Methoxy-thiazol-5-y1

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.235	H	H	C1	C1	4-Methyl-2-pyridyl	
1.236	H	H	C1	C1	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	
1.237	H	H	C1	C1	6-Methylthio-2-pyridyl	
1.238	H	H	C1	C1	6-Methoxy-3-pyridyl	
1.239	H	H	C1	C1	6-Methoxy-2-pyridyl	
1.240	H	H	C1	C1	6-Methyl-2-pyridyl	
1.241	H	H	C1	C1	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	
1.242	H	H	C1	C1	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	
1.243	H	H	C1	C1	5-Pyrimidiny1	
1.244	H	H	C1	C1	6-Dimethylamino-3-pyridyl	
1.245	H	H	C1	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-y1	
1.246	H	H	C1	C1	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-y1	
1.247	H	H	C1	C1	2-Methylthio-pyrimidin-5-y1	
1.248	H	H	C1	C1	2-Pyrimidiny1	
1.249	H	H	C1	C1	2-Methylthio-pyrimidin-4-y1	
1.250	H	H	C1	C1	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-y1	
1.251	H	H	C1	C1	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-y1	
1.252	H	H	C1	C1	4,5-Dihydro-thiazol-2-y1	
1.253	H	H	C1	C1	5-Methyl-oxazol-2-y1	
1.254	H	H	C1	C1	5-Phenyl-oxazol-2-y1	
1.255	H	H	C1	C1	2-Methyl-oxazol-5-y1	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.256	H	H	H	C1	C1	2-Phenyl-oxazol-5-y1
1.257	H	H	H	C1	C1	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-y1
1.258	H	H	H	C1	C1	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-y1
1.259	H	H	H	C1	C1	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-y1
1.260	H	H	H	C1	C1	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-y1
1.261	H	H	H	C1	C1	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-y1
1.262	H	H	H	C1	C1	5-Phenyl-isoxazol-3-y1
1.263	H	H	H	C1	C1	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-y1
1.264	H	H	H	C1	C1	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-y1
1.265	H	H	H	C1	C1	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazzin-2-y1
1.266	H	H	H	C1	C1	1,3-Dithiolan-2-y1
1.267	H	H	H	C1	C1	1,3-Dioxolan-2-y1
1.268	H	H	H	C1	C1	1,3-Dithian-2-y1
1.269	H	H	H	C1	C1	1,3-Dioxan-2-y1
1.270	H	H	H	C1	C1	1,3-Oxathiolan-2-y1
1.271	H	H	H	C1	C1	1,2,4-Triazol-1-y1
1.272	H	H	H	C1	C1	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-y1
1.273	H	H	H	C1	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-y1
1.274	H	H	H	C1	C1	Thiazolin-4,5-dion-2-y1
1.275	H	H	H	C1	C1	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-y1
1.276	H	H	H	C1	C1	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-y1

NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.277	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl
1.278	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Thienyl
1.279	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl
1.280	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Furyl
1.281	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.282	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Thiazolyl
1.283	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Thiazolyl
1.284	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thiazolyl
1.285	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.286	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isoxazolyl
1.287	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.288	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl
1.289	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Pyridyl
1.290	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Pyridyl
1.291	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.292	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.293	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Benzthiazzolyl
1.294	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Chinolinyl
1.295	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.296	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Oxazolyl
1.297	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Phenyl-pyrazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.298	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-3-y1
1.299	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-5-y1
1.300	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-y1
1.301	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Phenyl-pyrazol-3-y1
1.302	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-y1
1.303	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-y1
1.304	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-y1
1.305	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-4-y1
1.306	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-y1
1.307	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-oxazol-2-y1
1.308	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methylthio-thiazol-2-y1
1.309	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-y1
1.310	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-y1
1.311	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isopropyl-isoxazol-5-y1
1.312	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-y1
1.313	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-thiazol-2-y1
1.314	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Brom-2-thienyl
1.315	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-2-thienyl
1.316	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-2-thienyl
1.317	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-thiazol-2-y1
1.318	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Chlor-thiazol-2-y1

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.319	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4, 5-Dimethyl-thiazol-2-yl	
1.320	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Phenyl-thiazol-2-yl	
1.321	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methoxy-thiazol-5-yl	
1.322	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-2-pyridyl	
1.323	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	
1.324	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methylthio-2-pyridyl	
1.325	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methoxy-3-pyridyl	
1.326	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methoxy-2-pyridyl	
1.327	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methyl-2-pyridyl	
1.328	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2, 2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	
1.329	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2, 2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	
1.330	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Pyrimidinyl	
1.331	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Dimethylamino-3-pyridyl	
1.332	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1, 2, 4-Thiadiazol-5-yl	
1.333	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl	
1.334	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	
1.335	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyrimidinyl	
1.336	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	
1.337	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methylthio-1, 3, 4-thiadiazol-2-yl	
1.338	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methoxy-1, 3, 4-thiadiazol-2-yl	
1.339	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4, 5-Dihydro-thiazol-2-yl	

NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.340	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-oxazol-2-yl	
1.341	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-oxazol-2-yl	
1.342	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methyl-oxazol-5-yl	
1.343	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Phenyl-oxazol-5-yl	
1.344	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazo1-5-yl	
1.345	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazo1-5-yl	
1.346	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.347	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.348	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.349	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	
1.350	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazo1-2-yl	
1.351	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	
1.352	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazo1-2-yl	
1.353	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dithiolan-2-yl	
1.354	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dioxolan-2-yl	
1.355	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dithian-2-yl	
1.356	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dioxan-2-yl	
1.357	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Oxathiolan-2-yl	
1.358	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Triazol-1-yl	
1.359	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	
1.360	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.361	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	
1.362	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl	
1.363	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	
1.364	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Thienyl	
1.365	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Thienyl	
1.366	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Furyl	
1.367	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Furyl	
1.368	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Methyl-isoxazol-5-yl	
1.369	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Thiazolyl	
1.370	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Thiazolyl	
1.371	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Thiazolyl	
1.372	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Methyl-isothiazol-5-yl	
1.373	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Isoxazolyl	
1.374	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Phenyl-thiazol-2-yl	
1.375	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Pyridyl	
1.376	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Pyridyl	
1.377	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Pyridyl	
1.378	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1-Methyl-2-pyrrolyl	
1.379	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	
1.380	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Benzthiazolyl	
1.381	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Chinolinyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.382	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.383	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		2-Oxazoly1
1.384	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.385	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.386	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.387	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.388	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.389	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.390	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.391	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.392	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1-Methyl-pyrazol-4-yl
1.393	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.394	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		4-Methyl-oxazol-2-yl
1.395	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		5-Methylthio-thiazol-2-yl
1.396	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.397	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1.398	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1.399	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1.400	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		5-Methyl-thiazol-2-yl
1.401	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		4-Brom-2-thienyl
1.402	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		5-Methyl-2-thienyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.403	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Methyl-2-thienyl	
1.404	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Methyl-thiazol-2-yl	
1.405	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Chlor-thiazol-2-yl	
1.406	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl	
1.407	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Phenyl-thiazol-2-yl	
1.408	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Methoxy-thiazol-5-yl	
1.409	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4-Methyl-2-pyridyl	
1.410	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	
1.411	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-Methylthio-2-pyridyl	
1.412	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-Methoxy-3-pyridyl	
1.413	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-Methoxy-2-pyridyl	
1.414	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	
1.415	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	
1.416	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Pyrimidiny1	
1.417	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	6-Dimethylamino-3-pyridyl	
1.418	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	
1.419	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl	
1.420	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	
1.421	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Pyrimidiny1	
1.422	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	
1.423	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.424	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.425	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.426	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.427	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.428	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.429	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.430	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.431	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.432	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.433	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Trifluoromethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.434	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.435	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.436	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.437	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.438	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
1.439	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazipin-2-yl
1.440	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1,3-Dithiolan-2-yl
1.441	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1,3-Dioxolan-2-yl
1.442	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1,3-Dithian-2-yl
1.443	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1,3-Dioxan-2-yl
1.444	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CN	1,3-Oxathiolan-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.445	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,2,4-Triazol-1yl
1.446	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
1.447	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.448	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		Thiazolin-4,5-dion-2-yl
1.449	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl
1.450	H	H	SO ₂ CH ₃	CN		2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl
1.451	H	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Thienyl
1.452	H	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Thienyl
1.453	H	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Furyl
1.454	H	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Furyl
1.455	H	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.456	H	H	SO ₂ CH ₃	H		5-Thiazolyl
1.457	H	H	SO ₂ CH ₃	H		4-Thiazolyl
1.458	H	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Thiazolyl
1.459	H	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.460	H	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Isoxazolyl
1.461	H	H	SO ₂ CH ₃	H		5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.462	H	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Pyridyl
1.463	H	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Pyridyl
1.464	H	H	SO ₂ CH ₃	H		4-Pyridyl
1.465	H	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-2-pyrrolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.466	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.467	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Benzthiazolyl
1.468	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Chinolinyl
1.469	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.470	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Oxazolyl
1.471	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.472	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.473	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.474	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.475	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.476	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.477	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.478	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.479	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-pyrazol-4-yl
1.480	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.481	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.482	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methylthio-thiazol-2-yl
1.483	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.484	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1.485	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1.486	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.487	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-thiazol-2-yl
1.488	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Brom-2-thienyl
1.489	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-2-thienyl
1.490	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-2-thienyl
1.491	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-thiazol-2-yl
1.492	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Chlor-thiazol-2-yl
1.493	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
1.494	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1.495	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1.496	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-2-pyridyl
1.497	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.498	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methylthio-2-pyridyl
1.499	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methoxy-3-pyridyl
1.500	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methoxy-2-pyridyl
1.501	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methyl-2-pyridyl
1.502	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.503	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.504	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Pyrimidinyl
1.505	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.506	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.507	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.508	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methylthio-o-pyrimidin-5-yl
1.509	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Pyrimidinyl
1.510	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methylthio-o-pyrimidin-4-yl
1.511	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.512	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.513	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.514	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.515	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.516	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.517	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.518	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.519	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.520	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.521	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.522	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.523	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.524	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.525	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
1.526	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
1.527	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dithiolan-2-yl
1.528	H	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dioxolan-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.529	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Dithian-2-y1	
1.530	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Dioxan-2-y1	
1.531	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Oxathiolan-2-y1	
1.532	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 2, 4-Triazol-1-y1	
1.533	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-1, 2, 4-thiadiazol-5-y1	
1.534	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 2, 4-Thiadiazol-5-y1	
1.535	H	H	SO ₂ CH ₃	H	Thiazolin-4, 5-dion-2-y1	
1.536	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Oxo-3-H-1, 2, 4-di-thiazol-5-y1	
1.537	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Oxo-2-H-1, 3, 4-dithiazol-5-y1	
1.538	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Thienyl	
1.539	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Thienyl	
1.540	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Furyl	
1.541	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Furyl	
1.542	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-isoxazol-5-y1	
1.543	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Thiazoly1	
1.544	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Thiazoly1	
1.545	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Thiazoly1	
1.546	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-isothiazol-5-y1	
1.547	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Isoxazoly1	
1.548	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-thiazol-2-y1	
1.549	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Pyridyl	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.550	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		3-Pyridyl
1.551	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		4-Pyridyl
1.552	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-2-pyrrolyl
1.553	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.554	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Benzthiazolyl
1.555	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Chinolinyl
1.556	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.557	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		2-Oxazolyl
1.558	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.559	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.560	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.561	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.562	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.563	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.564	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.565	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.566	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1-Methyl-pyrazol-4-yl
1.567	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.568	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		4-Methyl-oxazol-2-yl
1.569	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		5-Methylthio-thiazol-2-yl
1.570	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H		4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl

NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.571	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1.572	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1.573	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1.574	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-thiazol-2-yl
1.575	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Brom-2-thienyl
1.576	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-2-thienyl
1.577	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-2-thienyl
1.578	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-thiazol-2-yl
1.579	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Chlor-thiazol-2-yl
1.580	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
1.581	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1.582	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1.583	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-2-pyridyl
1.584	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.585	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methylthio-2-pyridyl
1.586	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methoxy-3-pyridyl
1.587	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methyl-2-pyridyl
1.588	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.589	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.590	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Pyrimidinyl
1.591	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.592	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.593	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.594	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.595	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.596	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Pyrimidinyl
1.597	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.598	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyldiazo-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.599	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.600	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.601	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.602	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.603	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.604	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.605	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazo-1-5-yl
1.606	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazo-1-5-yl
1.607	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.608	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.609	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.610	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.611	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.612	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.613	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	5, 6-Dihydro-4H-1, 3-thiazin-2-yl
1.614	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Dithiolan-2-yl
1.615	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Dioxolan-2-yl
1.616	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Dithian-2-yl
1.617	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Dioxan-2-yl
1.618	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 3-Oxathiolan-2-yl
1.619	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 2, 4-Triazol-1-yl
1.620	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-1, 2, 4-thiadiazol-5-yl
1.621	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	1, 2, 4-Thiadiazol-5-yl
1.622	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	Thiazolin-4, 5-dion-2-yl
1.623	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Oxo-3-H-1, 2, 4-di-thiazol-5-yl
1.624	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Oxo-2-H-1, 3, 4-dithiazol-5-yl
1.625	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1.626	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1.627	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1.628	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1.629	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.630	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.631	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.632	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.633	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isothiazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.634	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.635	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.636	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
1.637	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
1.638	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
1.639	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.640	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.641	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.642	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.643	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.644	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Oxazolyl
1.645	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.646	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.647	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.648	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.649	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.650	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.651	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.652	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.653	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-4-yl
1.654	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.655	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.656	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methylthio-thiazol-2-yl
1.657	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.658	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1.659	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1.660	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1.661	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-thiazol-2-yl
1.662	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Brom-2-thienyl
1.663	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-2-thienyl
1.664	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-2-thienyl
1.665	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Chlor-thiazol-2-yl
1.666	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
1.667	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1.668	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1.669	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-2-pyridyl
1.670	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.671	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methylthio-2-pyridyl
1.672	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methoxy-3-pyridyl
1.673	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methoxy-2-pyridyl
1.674	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methyl-2-pyridyl
1.675	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.676	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.677	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.678	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.679	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.680	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.681	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.682	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.683	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyrimidinyl
1.684	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.685	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.686	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.687	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.688	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.689	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.690	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.691	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.692	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazo1-5-yl
1.693	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazo1-5-yl
1.694	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.695	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.696	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.697	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.698	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.699	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
1.700	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
1.701	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dithiolan-2-yl
1.702	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dioxolan-2-yl
1.703	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dithian-2-yl
1.704	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dioxan-2-yl
1.705	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Oxathiolan-2-yl
1.706	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Triazol-1-yl
1.707	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
1.708	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.709	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	Thiazolin-4,5-dion-2-yl
1.710	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl
1.711	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl
1.712	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl
1.713	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Thienyl
1.714	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl
1.715	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Furyl
1.716	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.717	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Thiazolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.718	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Thiazolyl
1.719	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thiazolyl
1.720	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.721	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isoxazolyl
1.722	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.723	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl
1.724	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Pyridyl
1.725	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Pyridyl
1.726	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.727	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.728	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Benzthiazolyl
1.729	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Chinolinyl
1.730	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.731	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Oxazolyl
1.732	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.733	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.734	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.735	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.736	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.737	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.738	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.739	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1, 5-Dimethyl-pyrazol-4-y1
1.740	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-4-y1
1.741	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1, 3-Dimethyl-pyrazol-5-y1
1.742	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-oxazol-2-y1
1.743	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methylthio-thiazol-2-y1
1.744	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-y1
1.745	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-y1
1.746	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isopropyl-isoxazol-5-y1
1.747	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-y1
1.748	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-thiazol-2-y1
1.749	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Brom-2-thienyl
1.750	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-2-thienyl
1.751	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-2-thienyl
1.752	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-1-thiazol-2-y1
1.753	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Chlor-thiazol-2-y1
1.754	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4, 5-Dimethyl-thiazol-2-y1
1.755	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Phenyl-thiazol-2-y1
1.756	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methoxy-thiazol-5-y1
1.757	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-2-pyridyl
1.758	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.759	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methylthio-2-pyridyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.760	CH ₃	H		SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methoxy-3-pyridyl
1.761	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methoxy-2-pyridyl
1.762	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methyl-2-pyridyl
1.763	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.764	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2,2,2-trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.765	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Pyrimidinyl
1.766	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.767	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.768	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.769	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.770	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyrimidinyl
1.771	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.772	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.773	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.774	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4,5-Dihydro-thiiazol-2-yl
1.775	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.776	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.777	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.778	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.779	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.780	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.781	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.782	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.783	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	
1.784	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	
1.785	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	
1.786	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	
1.787	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	
1.788	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dithiolan-2-yl	
1.789	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dioxolan-2-yl	
1.790	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dithian-2-yl	
1.791	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dioxan-2-yl	
1.792	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Oxathiolan-2-yl	
1.793	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Triazol-1-yl	
1.794	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	
1.795	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	
1.796	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	
1.797	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl	
1.798	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	
1.799	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl	
1.800	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Thienyl	
1.801	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.802	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Furyl
1.803	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.804	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Thiazolyl
1.805	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Thiazolyl
1.806	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Thiazolyl
1.807	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thiazolyl
1.808	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.809	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isoxazolyl
1.810	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.811	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl
1.812	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Pyridyl
1.813	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Pyridyl
1.814	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.815	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.816	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Benzthiazolyl
1.817	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Chinolinyl
1.818	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.819	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Oxazolyl
1.820	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.821	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.822	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-5-yl
						1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1. 823	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1. 824	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1. 825	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1. 826	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1. 827	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-pyrazol-4-yl
1. 828	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1. 829	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-oxazol-2-yl
1. 830	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methylthio-thiazol-2-yl
1. 831	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1. 832	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1. 833	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1. 834	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1. 835	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-thiazol-2-yl
1. 836	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Brom-2-thienyl
1. 837	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-2-thienyl
1. 838	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-thiazol-2-yl
1. 839	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Chlor-thiazol-2-yl
1. 840	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
1. 841	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1. 842	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1. 843	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.844	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-2-pyridyl
1.845	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.846	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methylthio-2-pyridyl
1.847	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methoxy-3-pyridyl
1.848	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methoxy-2-pyridyl
1.849	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methyl-2-pyridyl
1.850	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.851	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.852	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Pyrimidinyl
1.853	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.854	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.855	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.856	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.857	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyrimidinyl
1.858	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.859	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.860	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.861	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.862	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.863	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.864	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methyl-oxazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.865	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.866	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.867	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.868	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.869	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.870	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.871	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.872	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
1.873	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
1.874	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dithiolan-2-yl
1.875	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dioxolan-2-yl
1.876	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Oxathiolan-2-yl
1.877	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dithian-2-yl
1.878	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Dioxan-2-yl
1.879	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-Oxathiolan-2-yl
1.880	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Triazol-1-yl
1.881	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
1.882	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.883	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	Thiazolin-4,5-dion-2-yl
1.884	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazzol-5-yl
1.885	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazzol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1. 886	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1. 887	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1. 888	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1. 889	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1. 890	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1. 891	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
1. 892	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1. 893	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
1. 894	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1. 895	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1. 896	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1. 897	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
1. 898	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
1. 899	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
1. 900	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-2-pyrrolyl
1. 901	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1. 902	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1. 903	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
1. 904	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1. 905	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Oxazolyl
1. 906	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Phenyl-pyrazol-5-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.907	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.908	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.909	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.910	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.911	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.912	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.913	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.914	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-Methyl-pyrazol-4-yl
1.915	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.916	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.917	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methylthio-thiazol-2-yl
1.918	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.919	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1.920	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1.921	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1.922	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-thiazol-2-yl
1.923	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Brom-2-thienyl
1.924	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-2-thienyl
1.925	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-2-thienyl
1.926	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-thiazol-2-yl
1.927	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Chlor-thiazol-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.928	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
1.929	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1.930	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1.931	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-2-pyridyl
1.932	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.933	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methylthio-2-pyridyl
1.934	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methoxy-3-pyridyl
1.935	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methoxy-2-pyridyl
1.936	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methyl-2-pyridyl
1.937	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.938	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.939	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.940	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.941	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.942	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.943	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.944	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyrimidinyl
1.945	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.946	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.947	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.948	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.949	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.950	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.951	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.952	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.953	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
1.954	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Phenyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl
1.955	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Trifluoromethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.956	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.957	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.958	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.959	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.960	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
1.961	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
1.962	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dithiolan-2-yl
1.963	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dioxolan-2-yl
1.964	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Dithian-2-yl
1.965	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,3-Oxathiolan-2-yl
1.966	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Triazol-1-yl
1.967	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
1.968	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.969	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	

NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.970	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	Thiazolin-4,5-dion-2-yl
1.971	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl
1.972	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl
1.973	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Thienyl
1.974	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Thienyl
1.975	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Furyl
1.976	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Furyl
1.977	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.978	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Thiazolyl
1.979	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Thiazolyl
1.980	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Thiazolyl
1.981	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.982	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Isoxazolyl
1.983	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.984	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Pyridyl
1.985	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Pyridyl
1.986	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Pyridyl
1.987	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.988	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.989	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Benzthiazolyl
1.990	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Chinolinyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.991	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.992	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Oxazolyl
1.993	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.994	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.995	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.996	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.997	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.998	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.999	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.1000	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
1.1001	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-Methyl-pyrazol-4-yl
1.1002	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.1003	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1004	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methylthio-thiazol-2-yl
1.1005	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.1006	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
1.1007	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
1.1008	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
1.1009	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-thiazol-2-yl
1.1010	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Brom-2-thienyl
1.1011	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-2-thienyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1012	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-2-thienyl
1.1013	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-thiazol-2-yl
1.1014	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Chlor-thiazol-2-yl
1.1015	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
1.1016	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1.1017	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1.1018	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-2-pyridyl
1.1019	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.1020	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methylthio-2-pyridyl
1.1021	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methoxy-3-pyridyl
1.1022	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methoxy-2-pyridyl
1.1023	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Methyl-2-pyridyl
1.1024	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.1025	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.1026	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Pyrimidinyl
1.1027	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.1028	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.1029	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.1030	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl
1.1031	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Pyrimidinyl
1.1032	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1033	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.1034	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.1035	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.1036	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-oxazol-2-yl
1.1037	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-oxazol-2-yl
1.1038	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methyl-oxazol-5-yl
1.1039	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Phenyl-oxazol-5-yl
1.1040	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.1041	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.1042	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Trifluoromethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.1043	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.1044	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
1.1045	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.1046	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1-(4-Chlorophenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
1.1047	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
1.1048	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
1.1049	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dithiolan-2-yl
1.1050	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dioxolan-2-yl
1.1051	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dithian-2-yl
1.1052	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Dioxan-2-yl
1.1053	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,3-Oxathiolan-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1054	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,2,4-Triazol-1-yl
1.1055	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl
1.1056	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.1057	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	Thiazolin-4,5-dion-2-yl
1.1058	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	3-Oxo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl
1.1059	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	2-Oxo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl
1.1060	H	H	H	CF ₃	C1	2-Thienyl
1.1061	H	H	H	CF ₃	C1	3-Thienyl
1.1062	H	H	H	CF ₃	C1	2-Furyl
1.1063	H	H	H	CF ₃	C1	3-Furyl
1.1064	H	H	H	CF ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1065	H	H	H	CF ₃	C1	5-Thiazioly1
1.1066	H	H	H	CF ₃	C1	4-Thiazioly1
1.1067	H	H	H	CF ₃	C1	2-Thiazioly1
1.1068	H	H	H	CF ₃	C1	3-Isoxazoly1
1.1069	H	H	H	CF ₃	C1	2-Pyridyl
1.1070	H	H	H	CF ₃	C1	3-Pyridyl
1.1071	H	H	H	CF ₃	C1	4-Pyridyl
1.1072	H	H	H	CF ₃	C1	2-Benzthiazioly1
1.1073	H	H	H	CF ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1074	H	H	H	CF ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1075	H	H	H	CF ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1076	H	H	H	OCH ₃	C1	2-Thienyl
1.1077	H	H	H	OCH ₃	C1	3-Thienyl
1.1078	H	H	H	OCH ₃	C1	2-Furyl
1.1079	H	H	H	OCH ₃	C1	3-Furyl
1.1080	H	H	H	OCH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1081	H	H	H	OCH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1082	H	H	H	OCH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1083	H	H	H	OCH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1084	H	H	H	OCH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.1085	H	H	H	OCH ₃	C1	2-Pyridyl
1.1086	H	H	H	OCH ₃	C1	3-Pyridyl
1.1087	H	H	H	OCH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1088	H	H	H	OCH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.1089	H	H	H	OCH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1090	H	H	H	OCH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1091	H	H	H	OCH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1092	H	H	H	OCF ₃	C1	2-Thienyl
1.1093	H	H	H	OCF ₃	C1	3-Thienyl
1.1094	H	H	H	OCF ₃	C1	2-Furyl
1.1095	H	H	H	OCF ₃	C1	3-Furyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1096	H	H	H	OCF ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1097	H	H	H	OCF ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1098	H	H	H	OCF ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1099	H	H	H	OCF ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1100	H	H	H	OCF ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.1101	H	H	H	OCF ₃	C1	2-Pyridyl
1.1102	H	H	H	OCF ₃	C1	3-Pyridyl
1.1103	H	H	H	OCF ₃	C1	4-Pyridyl
1.1104	H	H	H	OCF ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.1105	H	H	H	OCF ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1106	H	H	H	OCF ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1107	H	H	H	OCF ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1108	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Thienyl
1.1109	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Thienyl
1.1110	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Furyl
1.1111	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Furyl
1.1112	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1113	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1114	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1115	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1116	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Isoxazolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1117	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Pyridyl
1.1118	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Pyridyl
1.1119	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1120	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.1121	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1122	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1123	H	H	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1124	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1.1125	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1.1126	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1.1127	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1.1128	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1129	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1130	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1131	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1132	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.1133	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
1.1134	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
1.1135	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1136	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.1137	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1138	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1139	H	H	H	NHSO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1140	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1.1141	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1.1142	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1.1143	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1.1144	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1145	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1146	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1147	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1148	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.1149	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
1.1150	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
1.1151	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1152	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Benzothiazolyl
1.1153	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1154	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1155	H	H	H	OSO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1156	H	H	H	OCOCH ₃	C1	2-Thienyl
1.1157	H	H	H	OCOCH ₃	C1	3-Thienyl
1.1158	H	H	H	OCOCH ₃	C1	2-Furyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1159	H	H	OCOCH ₃	C1	3-Furyl	
1.1160	H	H	OCOCH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl	
1.1161	H	H	OCOCH ₃	C1	5-Thiazolyl	
1.1162	H	H	OCOCH ₃	-	C1	4-Thiazolyl
1.1163	H	H	OCOCH ₃	C1	2-Thiazolyl	
1.1164	H	H	OCOCH ₃	C1	3-Isoxazolyl	
1.1165	H	H	OCOCH ₃	C1	2-Pyridyl	
1.1166	H	H	OCOCH ₃	C1	3-Pyridyl	
1.1167	H	H	OCOCH ₃	C1	4-Pyridyl	
1.1168	H	H	OCOCH ₃	C1	2-Benzthiazolyl	
1.1169	H	H	OCOCH ₃	C1	2-Chinoliny	
1.1170	H	H	OCOCH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl	
1.1171	H	H	OCOCH ₃	C1	5-Pyrimidinyl	
1.1172	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	2-Thienyl	
1.1173	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	3-Thienyl	
1.1174	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	2-Furyl	
1.1175	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	3-Furyl	
1.1176	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl	
1.1177	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	5-Thiazolyl	
1.1178	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	4-Thiazolyl	
1.1179	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	2-Thiazolyl	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1180	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	3-Isoxazolyl
1.1181	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	2-Pyridyl
1.1182	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	3-Pyridyl
1.1183	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	4-Pyridyl
1.1184	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	2-Benzthiazolyl
1.1185	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	2-Chinolinyl
1.1186	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1187	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	5-Pyrimidinyl
1.1188	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	2-Thienyl
1.1189	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	3-Thienyl
1.1190	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	2-Furyl
1.1191	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	3-Furyl
1.1192	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1193	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	5-Thiazolyl
1.1194	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	4-Thiazolyl
1.1195	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	2-Thiazolyl
1.1196	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	3-Isoxazolyl
1.1197	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	2-Pyridyl
1.1198	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	3-Pyridyl
1.1199	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	4-Pyridyl
1.1200	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	2-Benzthiazolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1201	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	2-Chinolinyl
1.1202	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1203	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CF ₃	5-Pyrimidinyl
1.1204	H	H	H	SOCH ₃	C1	2-Thienyl
1.1205	H	H	H	SOCH ₃	C1	3-Thienyl
1.1206	H	H	H	SOCH ₃	C1	2-Furyl
1.1207	H	H	H	SOCH ₃	C1	3-Furyl
1.1208	H	H	H	SOCH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1209	H	H	H	SOCH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1210	H	H	H	SOCH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1211	H	H	H	SOCH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1212	H	H	H	SOCH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.1213	H	H	H	SOCH ₃	C1	2-Pyridyl
1.1214	H	H	H	SOCH ₃	C1	3-Pyridyl
1.1215	H	H	H	SOCH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1216	H	H	H	SOCH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.1217	H	H	H	SOCH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1218	H	H	H	SOCH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1219	H	H	H	SOCH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1220	H	H	H	SCH ₃	C1	2-Thienyl
1.1221	H	H	H	SCH ₃	C1	3-Thienyl

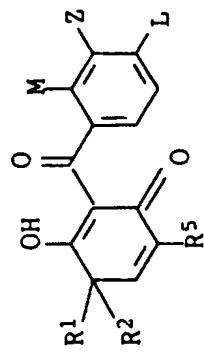
Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1222	H	H	H	SCH ₃	C1	2-Furyl
1.1223	H	H	H	SCH ₃	C1	3-Furyl
1.1224	H	H	H	SCH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1225	H	H	H	SCH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1226	H	H	H	SCH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1227	H	H	H	SCH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1228	H	H	H	SCH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.1229	H	H	H	SCH ₃	C1	2-Pyridyl
1.1230	H	H	H	SCH ₃	C1	3-Pyridyl
1.1231	H	H	H	SCH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1232	H	H	H	SCH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1.1233	H	H	H	SCH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1234	H	H	H	SCH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1235	H	H	H	SCH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1236	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Thienyl
1.1237	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Thienyl
1.1238	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Furyl
1.1239	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Furyl
1.1240	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1241	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	5-Thiazolyl
1.1242	H	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	4-Thiazolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1243	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Thiazolyl	
1.1244	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Isoxazolyl	
1.1245	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Pyridyl	
1.1246	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Pyridyl	
1.1247	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	4-Pyridyl	
1.1248	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Benzthiazolyl	
1.1249	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Chinolinyl	
1.1250	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl	
1.1251	H	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	5-Pyrimidinyl	
1.1252	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	2-Thienyl	
1.1253	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	3-Thienyl	
1.1254	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	2-Furyl	
1.1255	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	3-Furyl	
1.1256	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl	
1.1257	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	5-Thiazolyl	
1.1258	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	4-Thiazolyl	
1.1259	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	2-Thiazolyl	
1.1260	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	3-Isoxazolyl	
1.1261	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	2-Pyridyl	
1.1262	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	3-Pyridyl	
1.1263	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	4-Pyridyl	

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1264	H	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	2-Benzthiazolyl
1.1265	H	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	2-Chinolinyl
1.1266	H	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1267	H	H	H	C1	SO ₂ CH ₃	5-Pyrimidinyl
1.1268	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Thienyl
1.1269	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Thienyl
1.1270	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Furyl
1.1271	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Furyl
1.1272	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1273	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	5-Thiazolyl
1.1274	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	4-Thiazolyl
1.1275	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Thiazolyl
1.1276	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Isoxazolyl
1.1277	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Pyridyl
1.1278	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Pyridyl
1.1279	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	4-Pyridyl
1.1280	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Benzthiazolyl
1.1281	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Chinolinyl
1.1282	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1283	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	5-Pyrimidinyl
1.1284	H	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Oxazolyl

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z
1.1285	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Oxazoly1
1.1286	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Oxazoly1

Tabelle 2: Verbindungen der Struktur Ie



NR.	R ¹	R ²	R ⁵	L	M	Z
2.1	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
2.2	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
2.3	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
2.4	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
2.5	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
2.6	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
2.7	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazoly1
2.8	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazoly1
2.9	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly1
2.10	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
2.11	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
2.12	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
2.13	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazoly1

Nr.	R1	R ²	R ⁵	L	M	Z
2.14	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
2.15	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
2.16	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
2.17	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
2.18	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
2.19	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
2.20	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
2.21	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
2.22	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiaazoly1
2.23	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiaazoly1
2.24	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiaazoly1
2.25	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly1
2.26	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
2.27	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
2.28	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
2.29	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazoly1
2.30	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
2.31	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
2.32	CH ₃	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
2.33	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
2.34	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl

Nr.	R ¹	R ²	R ⁵	L	M	Z
2.35	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
2.36	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
2.37	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-y1
2.38	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
2.39	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
2.40	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
2.41	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
2.42	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
2.43	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
2.44	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
2.45	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
2.46	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
2.47	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-y1
2.48	CH ₃	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl

If

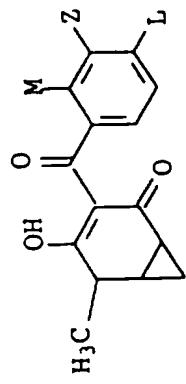


Tabelle 3: Verbindungen der Struktur If

Nr.	L	M	Z
3.1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
3.2	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
3.3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
3.4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
3.5	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
3.6	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
3.7	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
3.8	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
3.9	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
3.10	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
3.11	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
3.12	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
3.13	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
3.14	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl

Nr.	L	M	Z
3.15	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
3.16	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
3.17	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl
3.18	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Thienyl
3.19	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl
3.20	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Furyl
3.21	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Methyl-isoxazol-5-yl
3.22	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Thiazolyl
3.23	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Thiazolyl
3.24	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thiazolyl
3.25	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isoxazolyl
3.26	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl
3.27	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Pyridyl
3.28	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Pyridyl
3.29	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Benzothiazolyl
3.30	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Chinolinyl
3.31	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Methyl-oxazol-2-yl
3.32	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Pyrimidinyl

90

Ig

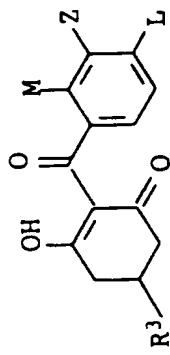


Tabelle 4: Verbindungen der Struktur Ig

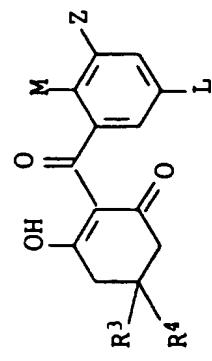
Nr.	R ³	L	M	Z
4.1	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.2	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.3	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.4	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.5	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.6	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.7	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.8	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4.9	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.10	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.11	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.12	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.13	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
4.14	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl

Nr.	R ³	L	M	Z
4.15	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.16	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
4.17	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.18	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.19	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.20	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.21	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.22	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.23	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.24	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4.25	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.26	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.27	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.28	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.29	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
4.30	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.31	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.32	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
4.33	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.34	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.35	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl

Nr.	R ³	L	M	Z
4.36	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.37	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-y1
4.38	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.39	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.40	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4.41	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.42	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.43	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.44	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.45	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
4.46	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.47	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-y1
4.48	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidiny1
4.49	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.50	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.51	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.52	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.53	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-y1
4.54	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.55	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.56	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl

Nr.	R ³	L	M	Z
4.57	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.58	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.59	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.60	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.61	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
4.62	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.63	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.64	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
4.65	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.66	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.67	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.68	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.69	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.70	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.71	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.72	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4.73	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.74	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.75	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.76	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.77	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl

Nr.	R ^J	L	M	Z
4.78	1-Methylthio-o-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.79	1-Methylthio-o-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.80	1-Methylthio-o-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
4.81	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.82	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.83	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.84	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.85	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.86	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.87	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.88	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4.89	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.90	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.91	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.92	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.93	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
4.94	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.95	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.96	(Dimethoxy)methyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl

Tabelle 5: Verbindungen der Struktur I^h

Nr.	R ³	R ⁴	L	M	Z
5.1	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
5.2	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
5.3	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
5.4	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
5.5	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
5.6	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
5.7	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
5.8	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
5.9	H	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
5.10	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
5.11	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
5.12	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
5.13	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
5.14	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl

Nr.	R ³	R ⁴	L	M	Z
5.15	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
5.16	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
5.17	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
5.18	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
5.19	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
5.20	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
5.21	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
5.22	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazzolyl
5.23	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
5.24	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
5.25	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
5.26	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
5.27	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden 5 Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

10

Unter Berücksichtigung der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die Verbindungen I bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen bei- 15 spielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spp. altissima, Beta vulgaris spp. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. 20 napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoinensis, Citrus limon, Citrus sinensis Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, 25 (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spp., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spp., Nicotiana tabacum 30 (N. rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spp., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, 35 Vitis vinifera, Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die 40 Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauf lauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so 45 können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit

nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

5 Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten 10 durch versprühen, vernebeln, verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

15 Als inerte Zusatzstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohle- teeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon oder stark polare Lösungsmittel, wie N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Be- tracht.

25 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub- 30 strate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, 35 die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z. B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, 40 sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kofldensationsprodukte des Naphthalins 45 bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Poly- oxyethylen- octylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonyl- phenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether,

Alkyaryl- polyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkohol- ethylen- oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxy- ethylenalkylether oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkohol- polyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder 5 Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

10

Granulate, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogen- granulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Träger- stoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalk- 15 stein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunst- stoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreide- mehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder 20 andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die Formulierungen enthalten im allgemeinen 0,001 bis 98 Gew.-%, vor- 25 zugsweise 0,01 bis 95 Gew. %, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie 30 folgt formuliert werden:

- I 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.1232 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungssproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

- II 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.1232 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungs- produktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol

100

Isooctylphenyl und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

5

III 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfaktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

10

IV 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

15

V 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

20

VI 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfosäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion

25

VII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 1.1232 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

30

35

40

45

101

VIII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 1.1232 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Emulphor EL besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

5

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Benzoylderivate I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstums-regulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Bei-

10 spielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3, 1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamaate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuran-derivate, Cyclohexan-1,3-dionederivate, die in 2-Stellung z. B. 15 eine Carboxy- oder Carbimino-Gruppe tragen, Chinolincarbonsäure-derivate, Imidazolinone, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Aryl-oxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.

20 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner 25 die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, 30 Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0.001 bis 3.0, vor-zugsweise 0.01 bis 1.0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

Anwendungsbeispiele

35 Die herbizide Wirkung der Benzoylderivate der Formel I ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden 40 nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteiler Düs en aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um 45 Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Test-

102

pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung werden die Testpflanzen je 5 nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen werden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie werden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige 10 Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung beträgt 0.125 bzw. 0.0625 kg/ha a.S.

die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C 15 bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

20 Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

25 Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

	Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
30	Abutilon theophrasti	Chinesischer Hanf	velvet leaf
	Amaranthus retroflexus	zurückgekrümpter Fuchsschwanz	redroot pigweed
	Echinochloa crus-galli	Hühnerhirse	barnyardgrass
35	Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
	Zea mays	Mais	Indian corn

Selektive herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

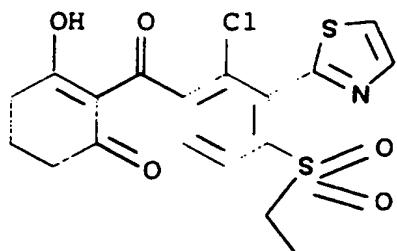
40

45

103

Tabelle 6

5



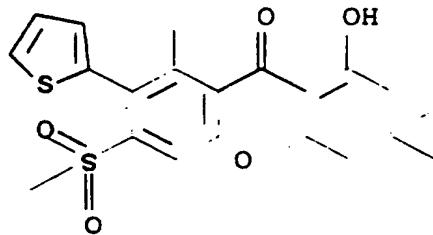
10

Bsp.-Nr. 1.1232

	Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,125	0,0625
15	Testpflanzen	Schädigung in %	
	ZEAMX	10	0
	ABUTH	100	95
	AMARE	100	100
20	ECHCG	98	95
	SOLNI	100	100

Tabelle 7
Herbizide sAktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus
25

30



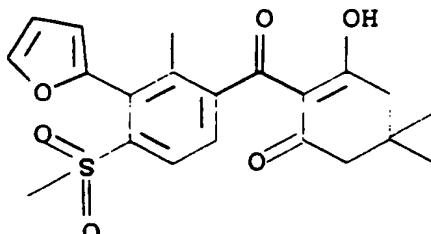
	Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,125	0,0625
35	Testpflanzen	Schädigung in %	
	ZEAMX	10	0
	ECHCG	95	95
40	CHEAL	95	95
	SINAL	90	90
	SOLNI	100	100

45

Tabelle 8

Herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

5



10

15

Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,125	0,0625
Testpflanzen	Schädigung in %	
ZEAMX	10	0
ECHCG	95	95
CHEAL	95	95

20 Herstellungsbeispiele

A) Herstellung der Ausgangsstoffe

1. 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonylbenzoesäuremethylester

25

a. Zu einer Suspension von 286 g (2.14 mol) Aluminiumtrichlorid in 420 ml 1,2-Dichlorethan wurde bei 15-20°C eine Lösung von 157 g (2 mol) Acetylchlorid in 420 ml 1,2-Dichlorethan getropft. Anschließend wurde eine Lösung von 346 g (2 mol) 2-Chlor-6-methylthio-toluol in 1 l 1,2-Dichlorethan zugetropft. Nach 12 Stunden Nachröhren wurde das Reaktionsgemisch in eine Mischung aus 3 l Eis und 1 l konz. HCl gegossen. Es wurde mit Methylenchlorid extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wurde im Vakuum destilliert.

Man erhielt 256 g (60 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon,

40

Fp.: 46°C

45

b. 163 g (0.76 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon wurden in 1,5 l Eisessig gelöst, mit 18,6 g Natriumwolframat versetzt und unter Kühlung 173,3 g 30 %ige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Es wurde 2 Tage nachgerührt und anschließend mit Wasser verdünnt. Der

105

ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

5 Man erhielt 164 g (88% d. Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon, Fp.: 110-111°C

10 c. 82 g (0.33 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon wurden in 700 ml Dioxan gelöst und bei Raumtemperatur mit 1 l einer 12,5 %igen Natriumhypochloritlösung versetzt. Anschließend wurde 1 Stunde bei 80°C nachgerührt. Nach dem Abkühlen bildeten sich zwei Phasen, von denen die untere mit Wasser verdünnt und schwach angesäuert wurde. Der ausgefallene Feststoff wurde mit Wasser nachgewaschen und getrocknet.

15 15 Man erhielt 60 g (73 % d.Th) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoësäure, Fp.: 230-231°C.

20 d. 100 g (0.4 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoësäure wurden in 1 l Methanol gelöst und bei Rückflußtemperatur 5 Stunden mit HCl begast. Anschließend wird eingeeengt.

25 Man erhielt 88.5 g (84 % d.Th.)
2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester,
Fp.: 107-108°C

30 e. 82 g (0.31 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester werden in 2 l Tetrachlormethan gelöst und unter Belichtung portionsweise mit 56 g (0.31 mol) N-Bromsuccinimid versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert, das Filtrat eingeeengt und der Rückstand in 200 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die Lösung wird mit Petrolether versetzt, der ausgefallene Feststoff abgesaugt und getrocknet.

35 Man erhielt 74.5 g (70 % d.Th)
3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester, Fp.: 74-75°C.

40 f. Eine Lösung von 41 g (0.12 mol) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester in 250 ml Acetonitril wurde mit 42.1 g (0.36 mol) N-Methylmorpholin-N-oxid versetzt. Der Ansatz wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt, anschließend eingeeengt und der Rückstand in Essigester aufgenommen. Die Lösung wurde mit

106

Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt.

Man erhielt 31,2 g (94 % d.Th.) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester, Fp.: 98-105°C

5 2. 2-Chlor-4-methylsulfonyl-3-(trifluormethylsulfonyl)oxy-benzoësäure-methylester

10 a. 101 g (0.41 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-4-methylsulfonyl-benzoësäure werden in 1,31 Methanol gelöst und unter Rückfluß 4 Stunden mit HCl begast. Die Lösung wurde eingeeengt, der Rückstand mit Dichlormethan aufgenommen und mit K₂CO₃-Lösung extrahiert. Die wäßrige Phase wurde mit verdünnter Salzsäure auf pH 7 eingestellt und mit Dichlormethan gewaschen. Anschließend wurde auf pH 1 angesäuert und das Produkt mit Dichlormethan extrahiert.

15 Man erhielt 76,2 g (71 % d.Th.) 2-Chlor-3-hydroxy-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester.

20 b. Eine Lösung aus 76 g (0,29 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester und 68 g Pyridin in 700 ml Dichlormethan wurde bei -20°C mit 89 g (0.32 mol) Trifluormethansulfansäureanhydrid versetzt. Die Lösung wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt, mit Dichlormethan verdünnt und mit Wasser extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulphat getrocknet und eingeeengt.

25 30 Man erhielt 94 g (82 % d.Th) 2-Chlor-4-methylsulfonyl-3-(trifluormethylsulfonyl)oxy-benzoësäure-methylester, Fp.: 69°C.

35 B) Herstellung der Zwischenprodukte

1. 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäure-methylester

40 a. 30 g (102 mmol) 3-Brom-4-methylsulfonyl-benzoësäure-methylester, 90 mg Palladiumdichlorid und 240 mg Tri-phenylphosphin in 200 ml Diethylamin und 60 ml Dimethylformamid werden mit 10 g (102 mmol) (Trimethylsilyl)-acetylen und 180 mg Kupfer-I-jodid versetzt und 4,5 Stunden bei 40°C gerührt. Anschließend wurde noch 12 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde

107

filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand über Kieselgel mit Toluol als Laufmittel chromatographiert.

5 Man erhielt 17,3 g (55% d.Th.) 4-Methylsulfonyl-3-(trimethylsilyl)ethinyl-benzoësäuremethylester als Öl.

10 b. 25 g 4-Methylsulfonyl-3-(trimethylsilyl)ethinyl-benzoësäuremethylester werden mit 100 ml Methanol und 0,9 g Kaliumkarbonat 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde vom Feststoff abgesaugt, eingeengt und mit Essigester/Wasser extrahiert. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

15 Man erhielt 15 g (79 % d.Th.) 4-Methylsulfonyl-3-ethinylbenzoësäure-methylester, Fp.: 95-98°C.

20 c. 13,5 g (57 mmol) 4-Methylsulfonyl-3-ethinyl-benzoësäure-methylester werden in 50 ml Dichlormethan gelöst, mit 5,2 g (60 mmol) Isobutyraldehydoxim versetzt und 41 g einer 12,5 %igen Natriumhypochloritlösung zugetropft. Anschließend wurde 24 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Der Reaktionsansatz wurde anschließend mit Dichlormethan/Wasser extrahiert, die organische Phase eingeengt und der Rückstand über Kieselgel mit Toluol/Essigester als Laufmittel chromatographiert.

25 Man erhielt 8,8 g (48 % d.Th) 3-(3-Isopropyl-isoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester, Fp.: 102-104°C.

30 2. 2-Chlor-3-(isoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäure-methylester

35 a. 15 g (54 mmol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester (Beisp. A.1.) und 4,2 g (60 mmol) Hydroxylaminhydrochlorid werden mit 300 ml Methanol gerührt und eine Lösung von 3,18 g (30 mmol) Natriumcarbonat in 80 ml Wasser zugetropft. Die Reaktionsmischung wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt, anschließend wird das Methanol abdestilliert und der Ansatz mit Ether/Wasser extrahiert. Die Etherphase wird mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

40 45 Man erhält 14,4 g (91% d.Th.) 2-Chlor-3-hydroxyimino-methyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester, Fp.: 126-128 °C.

108

b. 5,3 g (18 mmol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester werden in 50 ml Dichlormethan gelöst und bei 0-5°C 30 Minuten lang Acetylen eingeleitet. Anschließend wird mit einer Spatelspitze Natriumacetat versetzt und 15ml einer 10%igen Natriumhypochlorit-Lösung bei 10°C unter weiterer Acetylen-Einleitung zutropft. Nach beendeter Zugabe wird für weitere 15 Minuten Acetylen bei 10°C eingeleitet und anschließend 12 Stunden nachgerührt. Danach werden die Phasen getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

Man erhält 4,8 g (84 % d.Th.)
2-Chlor-3-(isoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester, Fp.: 145-147°C.

3. 2-Chlor-3-(thiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester
20 33 g (88 mmol) 2-(Tributylstanny1)-thiazol, 17,5 g (44 mmol) 2-Chlor-4-methylsulfonyl-3-(trifluormethylsulfonyl)oxy-benzoësäure-methylester (Beisp. A.2.), 5,8 g Lithiumchlorid, 1 g Tetrakis-(triphenylphosphin)-palladium-(0), eine Spatelspitze 2,6-Di-tert.-butyl-4-methyl-phenol und 200 ml 1,4-Dioxan werden in einem Autoklaven 3 Stunden bei 140°C unter Eigendruck gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung über eine Kieselgelschicht abfiltriert, mit Methyl-tert.-butyl-ether nachgewaschen und eingeengt. Der Rückstand wird über Kieselgel mit Toluol/Essigester als Laufmittel chromatographiert.

Man erhält 9,1 g (62,6% d.Th.)
2-Chlor-3-(thiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester, Fp.: 135-138°C.

35 4. 2-Chlor-3-(oxazol-5-yl)-4-methylsulfonylbenzoësäuremethylester

40 25 g (0,09 mol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester (Beispiel A.1), 17,6 g (0,09 mol) Tosylmethylenisocyanid und 6,2 g (0,045 mol) fein gepulvertes Kaliumkarbonat werden mit 450 ml Methanol 5 Stunden bei Rückflußtemperatur gerührt. Anschließend wird das Lösungsmittel abgezogen, der Rückstand in Essigester aufgenommen und mit Wasser extrahiert. Die Essigesterphase wird mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

109

Man erhält 24,7 g (87 % d.Th.) 2-Chlor-3-(oxazol-5-yl)-4-methylsulfon-benzoësäuremethylester, $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3)

δ: 8,24 (d, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 4,0 (s, 3H), 2,96 (s, 3H)

In analoger Weise werden die in der nachfolgenden Tabelle aufgeführten Zwischenprodukte erhalten:

10 Tabelle 9

15



20

25

30

35

40

45

Nr.	T	L	M	Z	Phys. Daten FP [°C]
9.1	Methoxy	-SO ₂ Me	Cl	3-Furyl	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ: 8,24 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,64 (m, 2H), 6,55 (s, 1H) 3,99 (s, 3H), 2,80 (s, 3H)
9.2	Methoxy	-SO ₂ Me	H	2-Thiazolyl	95 - 98
9.3	Ethoxy	-SO ₂ Et	Cl	2-Thiazolyl	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ: 8,18 (d, 1H), 7,97 (m, 2H), 7,71 (d, 1H), 4,47 (q, 2H) 3,36 (q, 2H), 1,42 (t, 3H), 1,24 (t, 3H)
9.4	OH	-SO ₂ CH ₃	Cl	2-Thiazolyl	288-290
9.5	OH	-SO ₂ CH ₃	Cl	2-Thienyl	177-180
9.6	OH	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl	175-178
9.7	OH	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl	167-171
9.8	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl	91-95
9.9	OH	-SO ₂ CH ₃	H	2-Furyl	219-223
9.10	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl	103-106
9.11	OH	-SO ₂ CH ₃	H	2-Thienyl	222-224
9.12	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	3-Isoxazoly	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ: 8,62 (1H); 8,18 (1H); 6,58 (1H); 3,98 (3H); 3,22 (3H)
9.13	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Phenyl-oxazol-2-yl	115-118
9.14	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Oxazolyl	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ: 8,76 (1H); 8,22 (1H); 8,10 (1H); 7,63 (1H); 4,04 (3H); 3,08 (3H)

110

5	9.15	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,20 (1H); 7,95 (1H); 6,12 (1H); 3,98 (3H); 3,22 (3H); 2,15 (1H); 1,03-1,09 (4H)
10	9.16	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,12 (1H); 7,98 (1H); 4,60 (1H); 3,98 (3H); 3,42 (2H); 3,25 (3H)
15	9.17	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	102-105
20	9.18	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	4,5-Dihydrooxazol-2-yl	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,08 (1H); 7,98 (1H); 4,57 (2H); 4,12 (2H); 3,98 (3H);
25	9.19	OH	-SO ₂ CH ₃	Cl	3-Furyl	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 13,29 (1H); 8,02 (1H); 7,67 (2H); 6,59 (1H); 2,83 (3H);
30	9.20	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	3-Thienyl	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,23 (1H); 7,84 (1H); 7,49 (2H); 7,13 (1H); 3,98 (3H); 2,62 (3H)
	9.21	OH	-SO ₂ CH ₃	H	3-Furyl	200-202
	9.22	OH	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Methyl-4-phenyl-thiazol-2-yl	200-204

C) Herstellung der Endprodukte

1. 2-[3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-cyclohexan-1,3-dior (Bsp.-Nr. 1.1232)

35

a. 8 g (25 mmol) 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäuremethylester (Beisp. B.1.) werden in 50 ml Methanol gelöst und mit 1,5 g (37 mmol) NaOH versetzt. Die Lösung wird 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird das Reaktionsgemisch eingeeengt, der Rückstand in Wasser aufgenommen und mit Salzsäure angesäuert. Nach längerem Rühren bilden sich hellgelbe Kristalle. Der Feststoff wird abgesaugt und getrocknet.

45

111

Man erhält 6,6 g (86% d.Th.) 3-(3-Isopropyl-isoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäure.
Fp.: 176-178 °C.

5 b. 6 g (19 mmol) 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäure werden in 60 ml Toluol gelöst, mit einem Tropfen Dimethylformamid versetzt und 3,2 g (27 mmol) Thionylchlorid zugegeben. Nach 4 Stunden Refluxieren wird das Reaktionsgemisch eingeengt.

10 Man erhält 6,3 g (99 % d.Th.) 3-(3-Isopropyl-isoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäurechlorid, Fp.: 102-105°C.

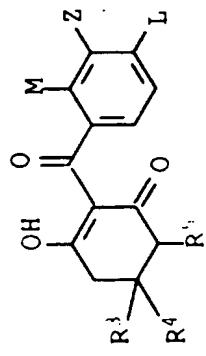
15 c. Zu einer Suspension von 0,5 g (4,6 mmol) Cyclohexadion-1,3 in 30 ml Dichlormethan gibt man 0,56 g (5,5 mmol) Triethylamin und tropft anschließend bei 25°C eine Lösung von 1,5 g (4,6 mmol) 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoësäurechlorid in 20 ml Dichlormethan zu. Anschließend wird 12 Stunden bei 40°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird mit Wasser verdünnt, die Dichlormethanphase abgetrennt über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird in 30 ml Acetonitril gelöst, mit 2,8 g Triethylamin und dann mit 0,15 g Acetoncyanhydrin versetzt und 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird der Reaktionsansatz eingeengt, der Rückstand in Essigester aufgenommen und mit verdünnter Salzsäure extrahiert. Nach zweimaligem Waschen mit Wasser wird die organische Phase mit 5%iger Kaliumcarbonatlösung extrahiert. Die wäßrige Phase wird auf pH 6 eingestellt und mit Essigester rückextrahiert. Nach Trocknen und Einengen erhält man 0,51 g (28 % d.Th.) 2-[3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-cylohexan-1,3-dion, Fp.: 95-98 °C.

In analoger Weise werden die in den nachfolgenden Tabellen aufgeführten Verbindungen erhalten:

40

45

Tabelle 10



Id

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z	FP [°C]
10.1	H	H	H	-SO ₂ Me	H	3-Isopropylisoxazol-5yl	95-98
10.2	Methyl	Methyl	H	-SO ₂ Et	C1	2-Thiazolyl	103-105
10.3	H	H	H	-SO ₂ Et	C1	2-Thiazolyl	112-115
10.4	H	H	H	-SO ₂ Me	C1	2-Thiazolyl	177
10.5	H	H	H	-SO ₂ Me	C1	3-Isoxazolyl	86-98
10.11	Methyl	H	H	-SO ₂ Me	C1	3-Isoxazolyl	186
10.12	H	H	H	-SO ₂ Me	C1	5-Oxazolyl	89-91
10.13	Methyl	H	H	-SO ₂ Me	C1	5-Oxazolyl	95-96
10.14	Methyl	Methyl	H	-SO ₂ Me	C1	5-Oxazolyl	101-106
10.15	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl	172
10.16	CH ₃	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl	180
10.17	(Dimethoxy)-methyl	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl	84-86

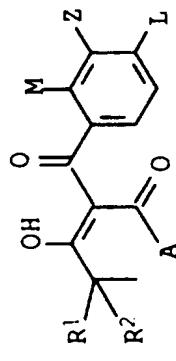
112

113

Nr.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z	FP [°C]
10.18	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl		110
10.19	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl	104
10.20	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	H	2-Furyl	79-82
10.21	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl	77-80
10.22	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl	75-79
10.23	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	4-Methylthiazol-2-yl	110
10.24	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Chlor-4-methylthiazol-2-yl	102-104
10.25	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly	102-105
10.26	H	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	230
10.27	H	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyclopropylisoxazol-3-yl	175-180
10.28	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyclopropylisoxazol-3-yl	162-172
10.29	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	204-205
10.30	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	115-120
10.31	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyclopropylisoxazol-3-yl	100-110
10.32	iso-Propyl	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly	127-130
10.33	iso-Propyl	H	H	-SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	178-180
10.34	H	H	H	-SO ₂ CH ₃	H	2-Furyl	65-68
10.35	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	H	2-Thienyl	81-84
10.36	H	H	H	-SO ₂ CH ₃	H	2-Thienyl	157-161
10.37	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl	149-153
10.38	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl	73-77

NR.	R ³	R ⁴	R ⁵	L	M	Z	FP [°C]
10.39	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	H	3-Furyl	100-104
10.40	H	H	H	-SO ₂ CH ₃	H	3-Furyl	64-68
10.41	CH ₃	CH ₃	H	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-4-phenylthiazol-2-y1	173

Tabelle 11



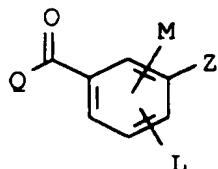
Nr.	R ¹	R ²	δ	L	M	Z	FP [OC] DZW. NMR	¹ H-
11.1	CH ₃	CH ₃	CH=CH	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl	82	
11.2	CH ₃	CH ₃	CH ₂ -CH ₃	-SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl	254-256	
11.3	CH ₃	CH ₃	CH ₂ -CH ₃	-SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dihydroxazol-3-yl	161-163	
11.4	CH ₃	CH ₃	CH ₂ -CH ₃	-SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl	125-130	

Patentansprüche

1. Benzoyllderivate der Formel I

5

10



in der die Substituenten folgende Bedeutungen haben:

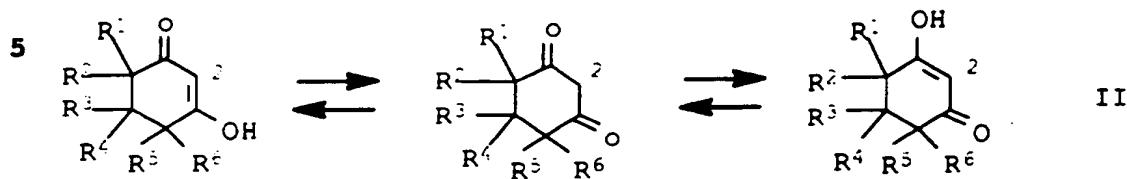
15 L, M Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,
ein bis fünf Halogenatome oder C₁-C₂-Alkoxy substituiert
sein können, Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe
-(Y)-S(O)-R¹ oder eine Gruppe -(Y)-CO-R²:

20 Z ein 5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter
oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Hetero-
atome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel
oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano,
Nitro, eine Gruppe -CO-R³, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogen-
alkyl, C₁-C₄-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-
alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
Di-C₁-C₄-Alkylamino, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano,
Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes
Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in
der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann,
substituiert ist oder der mit einem ankondensierten, ge-
gebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl
oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten Phenylring, einem
ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten,
gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl,
Di-C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten zweiten Hetero-
cyclus ein bicyclisches System bildet;

35 Y O, NR³;
n null oder eins;
m null, eins oder zwei;
R¹ C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder NR⁹R¹⁰;
R² C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, oder NR⁹R¹⁰;
40 R³ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
R¹⁰ C₁-C₄-Alkyl;

117

Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dionring der Formel II



10 in welcher

R¹, R², R⁴ und R⁶ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeuten,
R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder eine Gruppe -COOR³ bedeutet
R⁵ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl bedeutet, wobei
15 diese Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₄-Alkylthio, oder C₁-C₄-Alkoxy,

oder

20 R¹ Tetrahydropyranyl-3, Tetrahydropyranyl-4 oder Tetrahydro-thiopyranyl-3 bedeutet

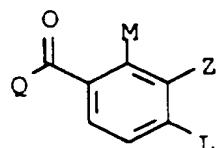
oder

25 R² und R³ gemeinsam eine Bindung oder einen drei- bis sechs-gliedrigen carbocyclischen Ring bilden

sowie landwirtschaftlich übliche Salze der Verbindungen I.

30 2. Benzoylederivate der Formel Ia

35



Ia

in der L für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano und M für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro

118

oder Cyano steht und Q und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

3. Benzooylderivate der Formel Ib

5

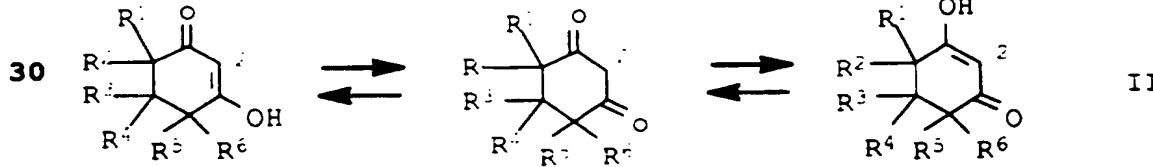
10



in der L und M für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano stehen und Q und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

4. Benzooylderivate der Formel I gemäß Anspruch 1 in der die Reste L bzw. M für Wasserstoff, Methyl, Methoxy, Methylthio, Chlor, Cyano, Methylsulfonyl, Nitro oder Trifluormethyl stehen.

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man die jeweiligen Ausgangsstoffe der Formel II



mit einem Benzoesäurederivat der Formel III

35

40



wobei T = Halogen bedeutet und L, M und Z die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, acyliert und das Acylierungsprodukt in Gegenwart eines Katalysators zu den Verbindungen I umlagert.

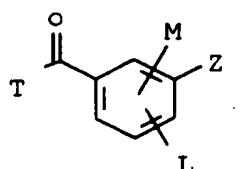
119

6. Herbizides Mittel, enthaltend mindestens ein Benzoylelderivat der Formel I gemäß Anspruch 1 und übliche inerte Zusatzstoffe.

5 7. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge eines Benzoylederivates der Formel I gemäß Anspruch 1 auf die Pflanzen oder deren Lebensraum einwirken läßt.

10 8. Benzoesäureederivate der Formel III

15



III

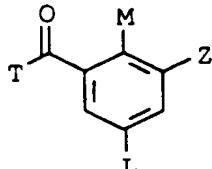
in der T die folgende Bedeutung hat:

20 T Halogen, OH oder C₁-C₄-Alkoxy

und L, M und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

9. Benzoylederivate der Formel IIIa
25

30



IIIa

in der T, L, M und Z die folgende Bedeutung haben:

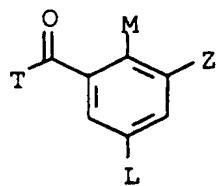
T Chlor, OH oder C₁-C₄-Alkoxy
35 L C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano
40 M C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano
Z wie in Anspruch 1 angegeben.

45

120

10. Benzoylderivate der Formel IIIb

5



10

in der T, L, M und Z die folgende Bedeutung haben:

T Chlor, OH oder C₁-C₄-AlkoxyL, M C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy,
C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,
C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen,

15

Nitro oder Cyano

Z wie in Anspruch 1 angegeben.

11. Benzoylderivate der Formel I gemäß Anspruch 1, in der Z ein
5- oder 6-gliedriger Heteroaromat bedeutet, enthaltend ein
20 bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff,
Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen,
Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cyclo-
alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio,
25 C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-C₁-C₄-Alkylamino, gegebenenfalls
durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogen-
alkyl substituiertes Phenyl substituiert ist oder ein gegebe-
nenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder
C₁-C₄-Halogenalkyl substituierter benzokondensierter 5- oder
6-Ring-Heteroaromat;
30 und L, M und Q die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben.

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inte nai Application No

PCT/EP 96/00593

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D307/54	C07D307/46	C07D333/24	C07D333/22	C07D263/32
C07D263/10	C07D261/08	C07D261/04	C07D277/30	C07D277/26
C07D271/06	A01N43/08	A01N43/10	A01N43/28	

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP,A,0 319 075 (NIPPON SODA CO) 7 June 1989 cited in the application see abstract; claims see page 15, line 6; examples ----	1-11
A	WO,A,90 05712 (ICI AMERICA INC) 31 May 1990 cited in the application see abstract; claims see page 31; example 21; table 14 -----	1-11

 Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *'A' document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *'E' earlier document but published on or after the international filing date
- *'L' document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *'O' document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *'P' document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *'T' later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *'X' document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *'Y' document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents such combination being obvious to a person skilled in the art
- *'&' document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 June 1996

Date of mailing of the international search report

14.06.96

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Paisdor, B

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No PCT/EP 96/00593	
---	--

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A-0319075	07-06-89	AT-T- 108764 CA-A- 1337818 DE-D- 3850749 JP-A- 2000726 US-A- 5110343	15-08-94 26-12-95 25-08-94 05-01-90 05-05-92
WO-A-9005712	31-05-90	US-A- 4957538 AT-T- 123752 AU-B- 635725 AU-B- 4743390 CA-A- 2003172 CN-B- 1024187 DE-D- 68923088 DE-T- 68923088 EP-A- 0444152 ES-T- 2073561 IL-A- 92341 JP-T- 4501726 RU-C- 2045512 TR-A- 24909	18-09-90 15-06-95 01-04-93 12-06-90 18-05-90 13-04-94 20-07-95 26-10-95 04-09-91 16-08-95 21-10-94 26-03-92 10-10-95 01-07-92

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Int. nationales Aktenzeichen

PCT/EP 96/00593

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES					
IPK 6	C07D307/54	C07D307/46	C07D333/24	C07D333/22	C07D263/32
	C07D263/10	C07D261/08	C07D261/04	C07D277/30	C07D277/26
	C07D271/06	A01N43/08	A01N43/10	A01N43/28	

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)

IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP,A,0 319 075 (NIPPON SODA CO) 7.Juni 1989 in der Anmeldung erwähnt siehe Zusammenfassung; Ansprüche siehe Seite 15, Zeile 6; Beispiele ---	1-11
A	WO,A,90 05712 (ICI AMERICA INC) 31.Mai 1990 in der Anmeldung erwähnt siehe Zusammenfassung; Ansprüche siehe Seite 31; Beispiel 21; Tabelle 14 -----	1-11

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

'A' Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

'E' älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

'L' Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

'O' Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,

eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

'P' Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

'T' Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

'X' Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

'Y' Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

'A' Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

6.Juni 1996

14. 06. 96

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Paisdor, B

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

late **oder Altenzeichen**

PCT/EP 96/00593

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP-A-0319075	07-06-89	AT-T-	108764	15-08-94
		CA-A-	1337818	26-12-95
		DE-D-	3850749	25-08-94
		JP-A-	2000726	05-01-90
		US-A-	5110343	05-05-92
-----	-----	-----	-----	-----
WO-A-9005712	31-05-90	US-A-	4957538	18-09-90
		AT-T-	123752	15-06-95
		AU-B-	635725	01-04-93
		AU-B-	4743390	12-06-90
		CA-A-	2003172	18-05-90
		CN-B-	1024187	13-04-94
		DE-D-	68923088	20-07-95
		DE-T-	68923088	26-10-95
		EP-A-	0444152	04-09-91
		ES-T-	2073561	16-08-95
		IL-A-	92341	21-10-94
		JP-T-	4501726	26-03-92
		RU-C-	2045512	10-10-95
		TR-A-	24909	01-07-92
-----	-----	-----	-----	-----